

VERIFIED TRANSLATION OF PCT

47790/97

IN THE MATTER OF an Australian  
Application corresponding to  
PCT Application PCT/EP97/05318

I, Dethard LAMPE Dipl.-Chem., PhD CChem MRSC,  
c/o Europa House, Marsham Way, Gerrards Cross, Buckinghamshire,  
England, do solemnly and sincerely declare that I am conversant  
with the English and German languages and am a competent  
translator thereof, and that to the best of my knowledge and  
belief the following is a true and correct translation of the  
PCT Application filed under No. PCT/EP97/05318.

Date: 26 March 1999

  
D. LAMPE

For and on behalf of RWS Group plc

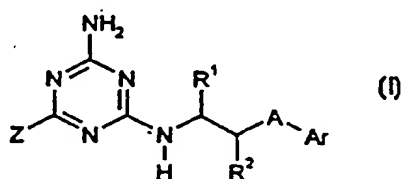
PCT WORLD ORGANISATION FOR INTELLECTUAL PROPERTY  
International Office  
INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International patent classification <sup>6</sup> : <b>C07D 251/18, A01N 43/68, C07D 401/12, 409/12</b>	<b>A1</b>	(11) International publication number: <b>WO 98/15537</b> [stamp] (43) International publication date: <b>16 April 1998 (16.04.98)</b>
(21) International application number: <b>PCT/EP97/05318</b> (22) International filing date: <b>29 September 1997 (29.09.97)</b> (30) Data relating to the priority: <b>196 41 691.4 10 October 1996 (10.10.96) DE</b> (71) Applicant (for all designated States except US): <b>BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE).</b> (72) Inventors: and (75) Inventors/Applicants (US only): <b>Hans-Jochem RIEBEL [DE/DE]; In der Beek 92, D-42113 Wuppertal (DE). Stefan LEHR [DE/DE]; Am Benthal 54, D-51381 Leverkusen (DE). Uwe STELZER [DE/DE]; Adolf-Kolping-Strasse 22a, D-51399 Burscheid (DE). Yukiyoishi WATANABE [JP/JP]; 2-8-24, Hanagaki-cho, Oyama-shi, Tochigi 323 (JP). Markus DOLLINGER [DE/DE]; Burscheider Strasse 154b, D-51381 Leverkusen (DE).</b> (74) Joint Representative: <b>BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).</b>		(81) Designated States: <b>AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ARIPO Patent (GH, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), Eurasian Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).</b>  Published: With the International Search Report. Before expiry of the period provided for amending the claims. Further publication will made if such amendments are received.

As printed

(54) Title: **SUBSTITUTED 2-AMINO-4-ALKYLAMINO-1,3,5-TRIAZINES AS HERBICIDES**

(54) Bezeichnung: **SUBSTITUIERTE 2-AMINO-4-ALKYLAMINO-1,3,5-TRIAZINE ALS HERBIZIDE**



**(57) Abstract**

The invention relates to novel substituted 2-amino-4-alkylamino-1,3,5-triazines of formula (I), in which R<sup>1</sup> stands for respectively optionally substituted alkyl with 2 to 6 carbon atoms or cycloalkyl with 3 to 6 carbon atoms, R<sup>2</sup> stands for hydrogen or alkyl with 1 to 4 carbon atoms, A for oxygen or methylene, Ar for respectively optionally substituted phenyl, naphthyl or heterocycyl, and Z for hydrogen, for halogen or for respectively optionally substituted alkyl, alkoxy, alkylcarbonyl, alkoxy carbonyl, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, alkenyl or alkynyl, methods and new intermediate products for their production and their use as herbicides.

**(57) Zusammenfassung**

Die Erfindung betrifft neue substituierte 2-Amino-4-alkylamino-1,3,5-triazine der Formel (I), in welcher R<sup>1</sup> für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, R<sup>2</sup> für Wasserstoff oder für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, A für Sauerstoff oder Methylen steht, Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl steht, und Z für Wasserstoff, für Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylcarbonyl, Alkoxy carbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkenyl oder Alkynyl steht, Verfahren und neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

# ONLY FOR INFORMATION

Codes used to identify the PCT member States on the flyleaves of the brochures in which international applications made under the PCT are published.

AL	Albania	LI	Liechtenstein
AM	Armenia	LK	Sri Lanka
AT	Austria	LR	Liberia
AU	Australia	LS	Lesotho
AZ	Azerbaijan	LT	Lithuania
BA	Bosnia-Herzegovina	LU	Luxembourg
BB	Barbados	LV	Latvia
BE	Belgium	MC	Monaco
BF	Burkina Faso	MD	Republic of Moldova
BG	Bulgaria	MG	Madagascar
BJ	Benin	MK	Former Yugoslav Republic of Macedonia
BR	Brazil	ML	Mali
BY	Belarus	MN	Mongolia
CA	Canada	MR	Mauritania
CF	Central African Republic	MW	Malawi
CG	Congo	MX	Mexico
CH	Switzerland	NE	Niger
CI	Ivory Coast	NL	Netherlands
CM	Cameroon	NO	Norway
CN	China	NZ	New Zealand
CU	Cuba	PL	Poland
CZ	Czech Republic	PT	Portugal
DE	Germany	RO	Romania
DK	Denmark	RU	Russian Federation
EE	Estonia	SD	Sudan
ES	Spain	SE	Sweden
FI	Finland	SG	Singapore
FR	France	SI	Slovenia
GA	Gabon	SK	Slovakia
GB	United Kingdom	SN	Senegal
GE	Georgia	SZ	Swaziland
GH	Ghana	TD	Chad
GN	Guinea	TG	Togo
GR	Greece	TJ	Tajikistan
HU	Hungary	TM	Turkmenistan
IE	Ireland	TR	Turkey
IL	Israel	TT	Trinidad and Tobago
IS	Iceland	UA	Ukraine
IT	Italy	UG	Uganda
JP	Japan	US	United States of America
KE	Kenya	UZ	Uzbekistan
KG	Kyrgyzstan	VN	Vietnam
KP	Democratic People's Republic of Korea	YU	Yugoslavia
KR	Republic of Korea	ZW	Zimbabwe
KZ	Kazakhstan		
LC	Saint Lucia		

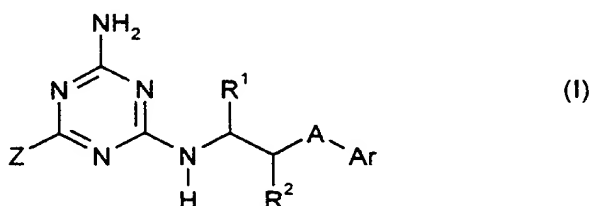
SUBSTITUTED 2-AMINO-4-ALKYLAMINO-1,3,5-TRIAZINES AS  
HERBICIDES

The invention relates to novel substituted 2-amino-4-alkylamino-1,3,5-triazines, to  
5 processes and to novel intermediates for their preparation and to their use as  
herbicides.

A number of substituted 2,4-diamino-triazines is already known from the (patent)  
literature (cf. US 3816419, US 3932167, EP 191496, EP 273328, EP 411153 / WO  
10 90/09378, WO 97/00254, WO 97/08156). However, these compounds have hitherto  
not attained any particular importance.

This invention, accordingly, provides the novel substituted 2-amino-4-alkylamino-  
1,3,5-triazines of the general formula (I)

15



in which

20 R<sup>1</sup> represents in each case optionally substituted alkyl having 2 to 6 carbon  
atoms or cycloalkyl having 3 to 6 carbon atoms,

R<sup>2</sup> represents hydrogen or represents alkyl having 1 to 4 carbon atoms,

25 A represents oxygen or methylene

Ar represents in each case optionally substituted phenyl, naphthyl or  
heterocyclyl, and



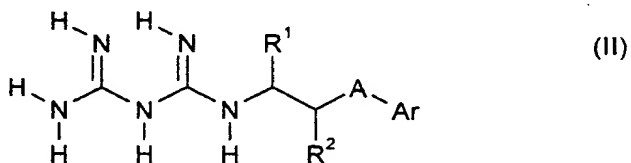
Z represents hydrogen, represents halogen or represents in each case optionally substituted alkyl, alkoxy, alkylcarbonyl, alkoxycarbonyl, alkylthio, alkylsulphinyl, alkylsulphonyl, alkenyl or alkynyl.

5

The novel 2-amino-4-alkylamino-1,3,5-triazines of the general formula (I) are obtained when

(a) substituted biguanides of the general formula (II),

10



in which

15 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A and Ar are each as defined above

- and/or acid adducts of compounds of the general formula (II) -

are reacted with alkoxycarbonyl compounds of the general formula (III)

20



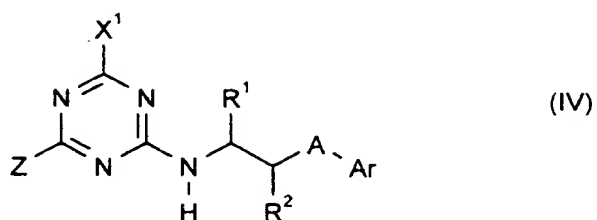
in which

25 Z is as defined above and

R' represents alkyl,

if appropriate in the presence of a reaction auxiliary and if appropriate in the presence of a diluent,  
or when

- 5 (b) substituted triazines of the general formula (IV)



in which

10

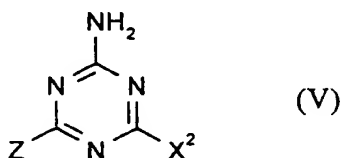
$R^1$ ,  $R^2$ , A, Ar and Z are each as defined above and

$X^1$  represents halogen or alkoxy

- 15 are reacted with ammonia, if appropriate in the presence of a reaction auxiliary and if appropriate in the presence of a diluent,

or when

- 20 (c) substituted triazines of the general formula (V),



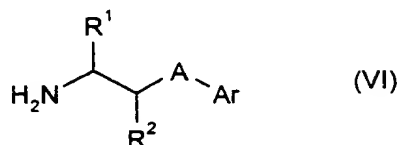
in which

25

Z is as defined above and

X<sup>2</sup> represents halogen or alkoxy

5 are reacted with substituted alkylamines of the general formula (VI),



in which

10

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A and Ar are each as defined above,

if appropriate in the presence of a reaction auxiliary and if appropriate in the presence of a diluent,

15

and, if appropriate, further conversions within the scope of the above definition of substituents are carried out by customary methods on the compounds of the general formula (I) obtained by the processes described under (a), (b) or (c).

20 The novel substituted 2-amino-4-alkylamino-1,3,5-triazines of the general formula (I) have strong and selective herbicidal activity.

The compounds of the general formula (I) according to the invention contain at least one asymmetrically substituted carbon atom and can therefore be present in different enantiomeric (R- and S-configured forms) or diastereomeric forms. The invention relates both to the different possible individual enantiomeric or stereoisomeric forms of the compounds of the general formula (I), and to the mixtures of these isomeric compounds.

25

In the definitions, the hydrocarbon chains, such as alkyl - also in combination with heteroatoms, such as in alkoxy or alkylthio - are in each case straight-chain or branched.

Halogen generally represents fluorine, chlorine, bromine or iodine, preferably  
5 represents fluorine, chlorine or bromine, and in particular represents fluorine or chlorine.

The invention preferably provides compounds of the formula (I) in which

10  $R^1$  represents optionally hydroxyl-, cyano-, halogen- or  $C_1$ - $C_4$ -alkoxy-substituted alkyl having 2 to 4 carbon atoms or represents optionally cyano-, halogen- or  $C_1$ - $C_4$ -alkyl-substituted cycloalkyl having 3 to 6 carbon atoms,

$R^2$  represents hydrogen, methyl or ethyl,  
15

A represents oxygen or methylene,

Ar represents in each case optionally substituted phenyl, naphthyl or heterocyclyl,  
20

where the possible heterocyclyl groupings are preferably selected from the group below:

furyl, benzofuryl, dihydrobenzofuryl, tetrahydrofuryl, thienyl, benzothienyl,  
25 thiazolyl, benzothiazolyl, oxazolyl, benzoxazolyl, thiadiazolyl, oxadiazolyl, pyrazolyl, pyrrolyl, quinoliny, isoquinoliny, pyridiny and pyrimidiny,

and where the possible substituents are in each case preferably selected from the group below:

30

hydroxyl, cyano, nitro, halogen, in each case optionally hydroxyl-, cyano- or halogen-substituted alkyl or alkoxy having in each case 1 to 6 carbon atoms, in each case optionally halogen-substituted alkylcarbonyl, alkoxycarbonyl, alkylthio, alkylsulphinyl or alkylsulphonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms in the alkyl groups, in each case optionally hydroxyl-, cyano-, nitro-, halogen-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-halogenoalkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy- or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-halogenoalkoxy-substituted phenyl or phenoxy, and also in each case optionally halogen-substituted methylenedioxy or ethylenedioxy,

and

Z represents hydrogen, represents halogen, represents in each case optionally hydroxyl-, cyano-, nitro-, halogen-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-carbonyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-carbonyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylthio-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylsulphinyl- or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylsulphonyl-substituted alkyl, alkoxy, alkylcarbonyl, alkoxycarbonyl, alkylthio, alkylsulphinyl or alkylsulphonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms in the alkyl groups, or represents in each case optionally halogen-substituted alkenyl or alkynyl having in each case 2 to 6 carbon atoms.

From among the compounds of the formula (I) defined above as preferred ("preferably"), particular emphasis is given to the following groups:

(A) the compounds of the formula (I) in which A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> and Z are each as defined above and Ar represents in each case optionally substituted phenyl or naphthyl, the possible substituents being as defined above;

(B) the compounds of the formula (I) in which A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> and Z are each as defined above and Ar represents in each case optionally substituted heterocyclyl, the possible heterocyclyl groupings and the possible substituents being as defined above.

The invention in particular relates to compounds of the formula (I) in which

R<sup>1</sup> represents in each case optionally hydroxyl-, cyano-, fluorine-, chlorine-, methoxy- or ethoxy-substituted ethyl, n- or i-propyl, n-, i-, s- or t-butyl or  
5 represents in each case optionally cyano-, fluorine-, chlorine-, methyl- or ethyl-substituted cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl or cyclohexyl,

R<sup>2</sup> represents hydrogen or methyl,

A represents oxygen or methylene,  
10

Ar represents in each case optionally substituted phenyl, naphthyl or heterocyclyl,

where the possible heterocyclyl groups are preferably selected from the group  
15 below:

furyl, benzofuryl, dihydrobenzofuryl, tetrahydrofuryl, thienyl, benzothienyl, thiazolyl, benzothiazolyl, oxazolyl, benzoxazolyl, thiadiazolyl, oxadiazolyl, pyrazolyl, pyrrolyl, quinoliny, isoquinoliny, pyridiny and pyrimidiny,  
20

and where the possible substituents are in each case preferably selected from the group below:

hydroxyl, cyano, nitro, fluorine, chlorine, bromine, in each case optionally  
25 hydroxyl- cyano-, fluorine- or chlorine-substituted methyl, ethyl, n- or i-propyl, n-, i-, s- or t-butyl, methoxy, ethoxy, n- or i-propoxy, n-, i-, s- or t-butoxy, in each case optionally fluorine- or chlorine-substituted acetyl, propionyl, n- or i-butyroyl, methoxycarbonyl, ethoxycarbonyl, n- or i-propoxycarbonyl, methylthio, ethylthio, n- or i-propylthio, methylsulphiny, ethylsulphiny, n- or i-propylsulphiny, methylsulphony, ethylsulphony, n-  
30 or i-propylsulphony, in each case optionally hydroxyl-, cyano-, nitro-,

5 fluorine-, chlorine-, bromine-, methyl-, ethyl-, n- or i-propyl-, n-, i-, s- or t-butyl-, trifluoromethyl-, methoxy-, ethoxy-, n- or i-propoxy-, n-, i-, s- or t-butoxy-, difluoromethoxy- or trifluoromethoxy-substituted phenyl or phenoxy, and also in each case optionally fluorine- or chlorine-substituted methylenedioxy or ethylenedioxy,

and

10 Z represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, represents in each case optionally hydroxyl-, cyano-, nitro-, fluorine-, chlorine-, methoxy-, ethoxy-, n- or i-propoxy-, n-, i-, s- or t-butoxy-, methylthio-ethylthio-, n- or i-propylthio-, methylsulphinyl-, ethylsulphinyl-, n- or i-propylsulphinyl-, methylsulphonyl-, ethylsulphonyl-, n- or i-propylsulphonyl-substituted methyl, ethyl, n- or i-propyl, n-, i-, s- or t-butyl, methoxy, ethoxy, n- or i-propoxy, n-, i-, s- or t-butoxy, methylthio, ethylthio, n- or i-propylthio, methylsulphinyl, ethylsulphinyl, n- or i-propylsulphinyl, methylsulphonyl, ethylsulphonyl, n- or i-propylsulphonyl, or represents in each case optionally fluorine-, chlorine- or bromine-substituted ethenyl, propenyl, butenyl, ethinyl, propinyl or butinyl.

20

From among the compounds of the formula (I) defined above as being particularly preferred, particular emphasis is given to the following groups:

25 (AA) the compounds of the formula (I) in which A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> and Z are each as defined above and Ar represents in each case optionally substituted phenyl or naphthyl, the possible substituents being as defined above, with the proviso that the substituents of the carbon atom to which R<sup>1</sup> is attached are arranged in the R configuration;

30 (BB) the compounds of the formula (I) in which A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> and Z are each as defined above and Ar represents in each case optionally substituted phenyl or naphthyl, the

possible substituents being as defined above, with the proviso that the substituents of the carbon atom to which  $R^1$  is attached are arranged in the S configuration;

5 (CC) the compounds of the formula (I) in which A,  $R^1$ ,  $R^2$  and Z are each as defined above and Ar represents in each case optionally substituted furyl, thienyl, pyridinyl or pyrimidinyl, the possible substituents being as defined above, with the proviso that these compounds are present as racemic mixtures;

10 (DD) the compounds of the formula (I) in which A,  $R^1$ ,  $R^2$  and Z are each as defined above and Ar represents in each case optionally substituted furyl, thienyl, pyridinyl or pyrimidinyl, the possible substituents being as defined above, with the proviso that the substituents of the carbon atom to which  $R^1$  is attached are arranged in the R configuration;

15 (EE) the compounds of the formula (I), in which A,  $R^1$ ,  $R^2$  and Z are each as defined above and Ar represents in each case optionally substituted furyl, thienyl, pyridinyl or pyrimidinyl, the possible substituents being as defined above, with the proviso that the substituents of the carbon atom to which  $R^1$  is attached are arranged in the S configuration;

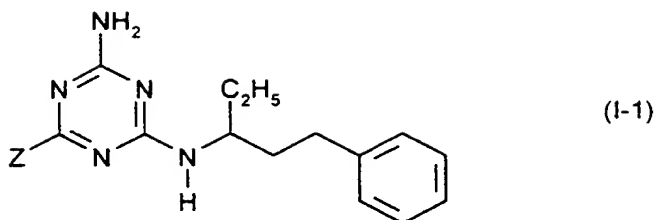
20

The abovementioned general or preferred radical definitions apply both to the end products of the formula (I) and also, correspondingly, to the starting materials or intermediates required in each case for the preparation. These radical definitions can be combined with each other at will, i.e. including combinations between the  
25 abovementioned preferred ranges.

Examples of the compounds of the formula (I) according to the invention are listed in the groups below. The general formulae here represent in each case the R enantiomers, the S enantiomers and the racemates.



Group 1



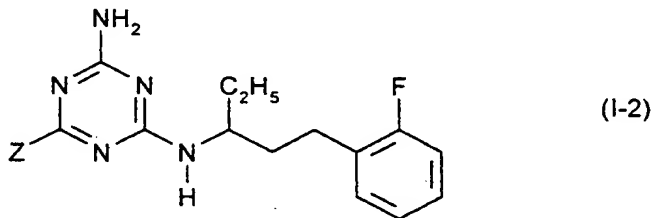
5 Here, Z has, for example, the meanings given below:

- Hydrogen, methyl, ethyl, n- or i-propyl, n-, i-, s- or t-butyl, fluoromethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, chloromethyl, dichloromethyl, chlorofluoromethyl, chlorobromomethyl, chlorodifluoromethyl, fluorodichloromethyl, bromodifluoromethyl, trichloromethyl, 1-fluoro-ethyl, 2-fluoro-ethyl, 1-chloro-ethyl, 2-chloro-ethyl, 1-chloro-1-fluoro-ethyl, 1-fluoro-propyl, 2-fluoro-propyl, 3-fluoro-propyl, 1-fluoro-1-methyl-ethyl, 2-fluoro-1-methyl-ethyl, 1-chloro-1-methyl-ethyl, 1-fluoro-1-methyl-propyl, 1-chloro-1-ethyl-propyl, 1-fluoro-1-ethyl-propyl, 1-chloro-1-ethyl-propyl, 1-fluoro-2-methyl-propyl, 1-chloro-2-methyl-propyl, 1-chloro-propyl, 2-chloro-propyl, 3-chloro-propyl, 1-chloro-1-methyl-ethyl, 2-chloro-1-methyl-ethyl, 1,1-difluoro-ethyl, 1,2-difluoro-ethyl, 1,1-dichloro-ethyl, 2,2,2-trifluoro-ethyl, 1,2,2,2-tetrafluoro-ethyl, perfluoroethyl, 1,1-difluoro-propyl, 1,1-dichloro-propyl, perfluoropropyl, 1-fluoro-butyl, 1-chloro-butyl, perfluoropentyl, perfluorohexyl, 1-hydroxyl-ethyl, acetyl, 1,1-bis-acetyl-methyl, 1-acetyl-1-methoxycarbonyl-methyl, 1-acetyl-1-ethoxycarbonyl-methyl, methoxymethyl, 1,1-dimethoxy-methyl, 1-methoxyethyl, 2-methoxy-ethyl, 1,1-dimethoxy-ethyl, ethoxymethyl, 1-ethoxyethyl, 2-ethoxy-ethyl, 2-methoxy-1-methyl-ethyl, 2-methoxy-1-ethyl-ethyl, 2-ethoxy-1-methyl-ethyl, 2-ethoxy-1-ethyl-ethyl, methylthiomethyl, ethylthiomethyl, 1-methylthio-ethyl, 2-methylthioethyl, 1-ethylthio-ethyl, 2-ethylthioethyl, methylsulphinylmethyl, ethylsulphinylmethyl, methylsulphonylmethyl, ethylsulphonylmethyl, methoxy, ethoxy, n- or i-propoxy, methylthio, ethylthio, n- or i-propylthio, methylsulphinyl, ethylsulphinyl, methylsulphonyl, ethylsulphonyl, fluoromethoxy, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, fluoroethoxy, difluoroethoxy,

trifluoroethoxy, difluoromethylthio, trifluoromethylthio, vinyl, 1-chloro-vinyl, 2-chloro-vinyl, 1-fluoro-vinyl, 2-fluoro-vinyl, 1-bromo-vinyl, 2-bromo-vinyl, 1,2-dichloro-vinyl, 1,2-dibromo-vinyl, 1,2-difluoro-vinyl, 2,2-dichloro-vinyl, 2,2-difluoro-vinyl, 2,2-dibromo-vinyl, 1-chloro-2-fluoro-vinyl, 2-bromo-2-chloro-vinyl, 5 trichlorovinyl, allyl, 2-chloro-allyl, 3-chloro-allyl, 3,3-dichloro-allyl, 1-propenyl, isopropenyl, 1-chloro-2-propenyl, 1-fluoro-2-propenyl, 1-bromo-2-propenyl, 1,2-dichloro-1-propenyl, 1,2-dibromo-1-propenyl, 1,2-difluoro-1-propenyl, 1,1-dichloro-2-propenyl, 1,1-dibromo-2-propenyl, 1,1-difluoro-2-propenyl, 1,1,3,3,3-pentafluoro-2-propenyl, 2-buten-1-yl, 2-buten-2-yl, 3-chloro-2-butenyl, 3-bromo-2-butenyl, 10 3,3,3-trifluoro-2-butenyl, ethinyl, 2-chloro-ethinyl, 2-bromo-ethinyl, 1-propinyl, 2-propinyl, 3,3,3-trifluoro-1-propinyl.

## Group 2

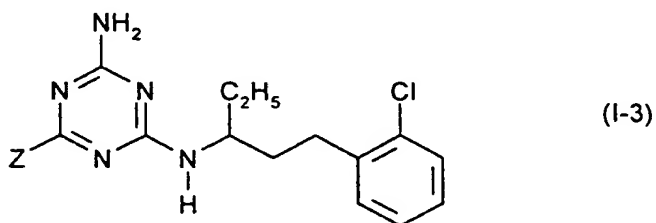
15



Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

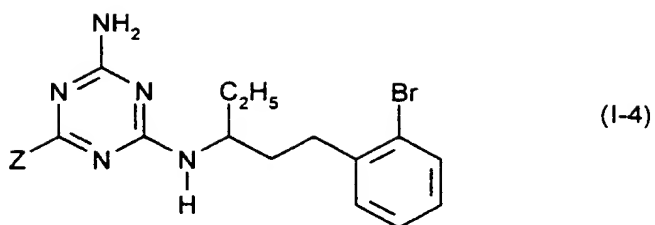
## Group 3

20



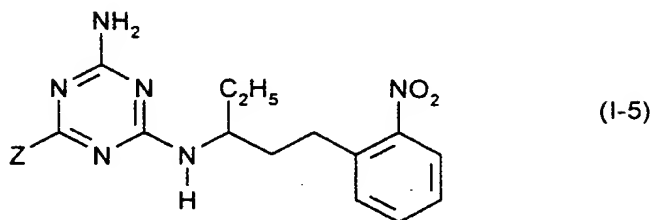
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 4



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

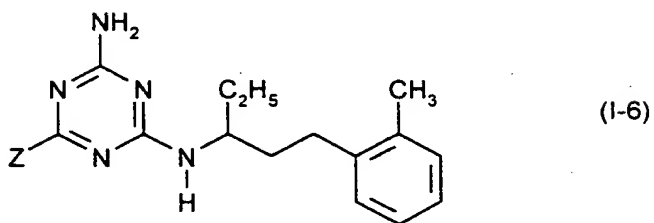
Group 5



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

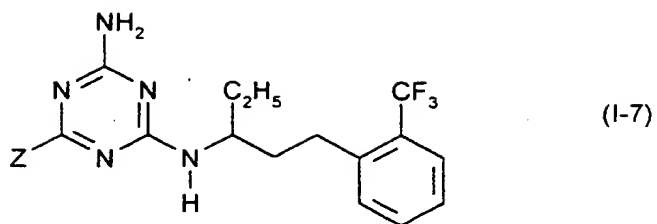
Group 6



15

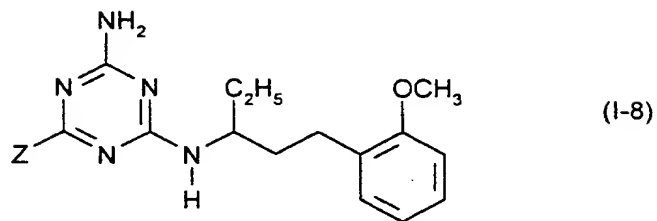
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 7



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

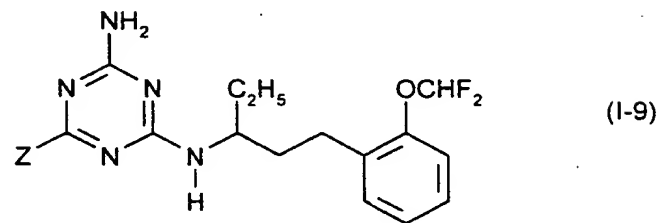
Group 8



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

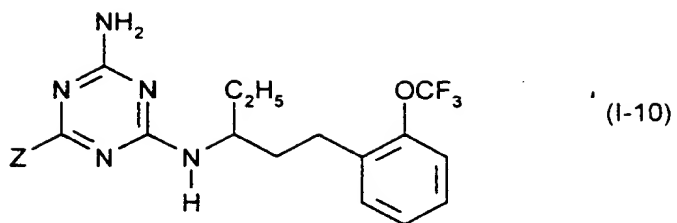
Group 9



15

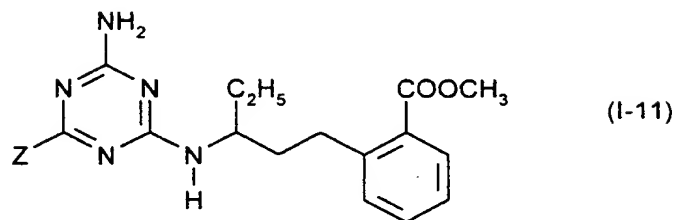
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 10



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

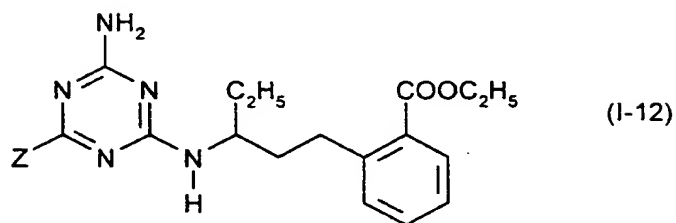
Group 11



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

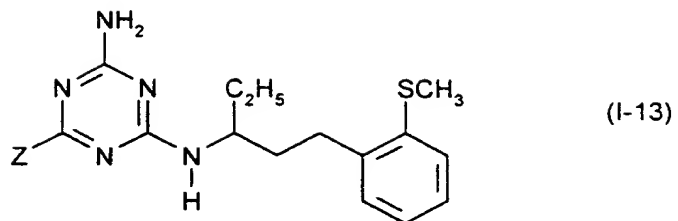
Group 12



15

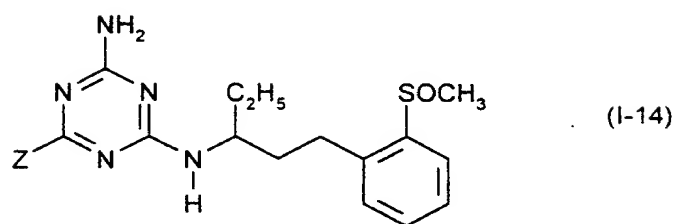
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 13



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

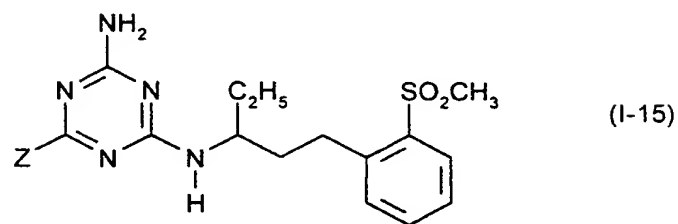
Group 14



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

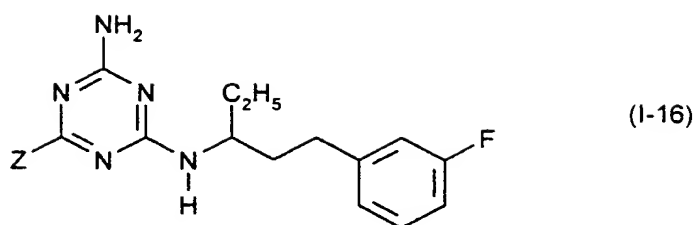
Group 15



15

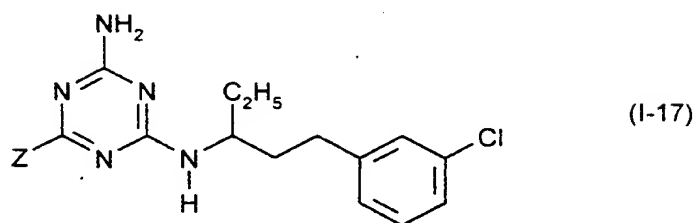
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 16



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

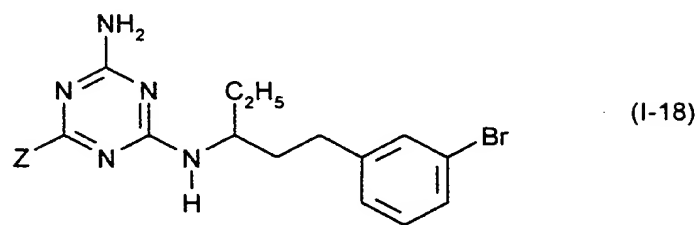
Group 17



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

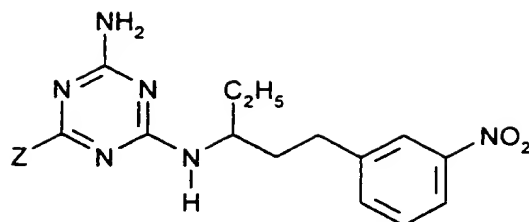
Group 18



15

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

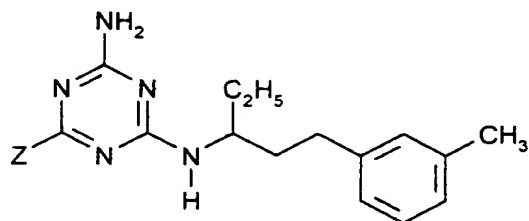
Group 19



(I-19)

5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 20

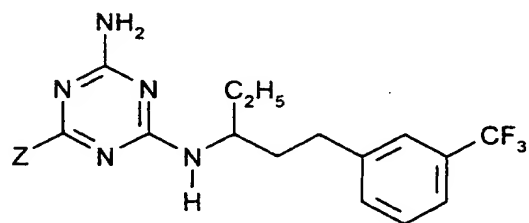


(I-20)

10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 21



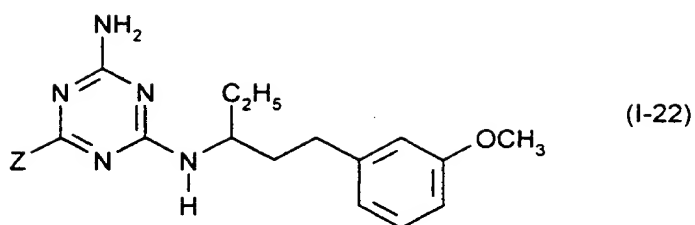
(I-21)

15

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

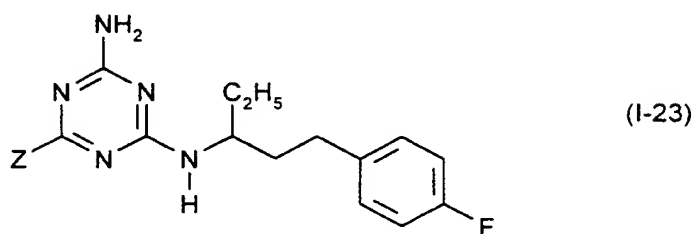


Group 22



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

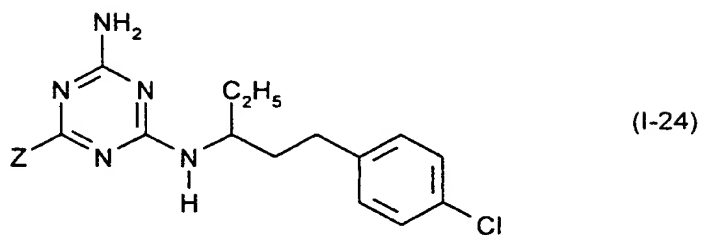
Group 23



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

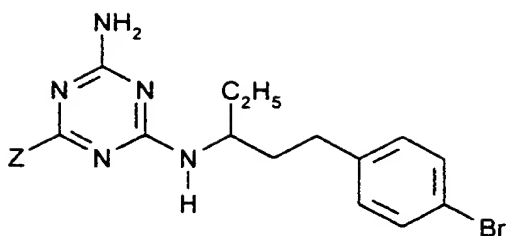
Group 24



15

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

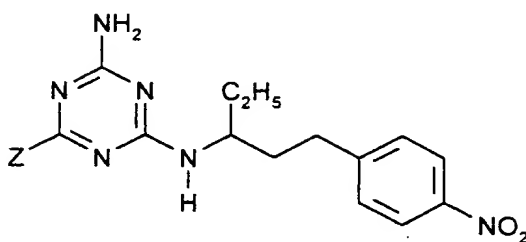
Group 25



(I-25)

5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 26

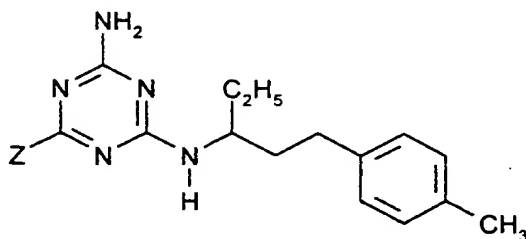


(I-26)

10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 27

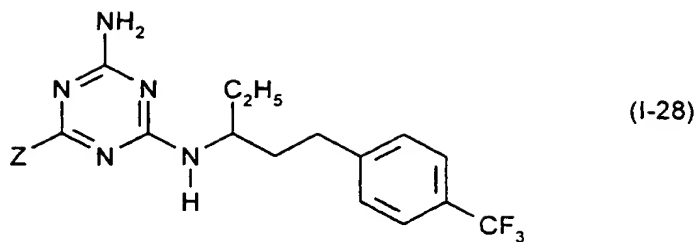


(I-27)

15

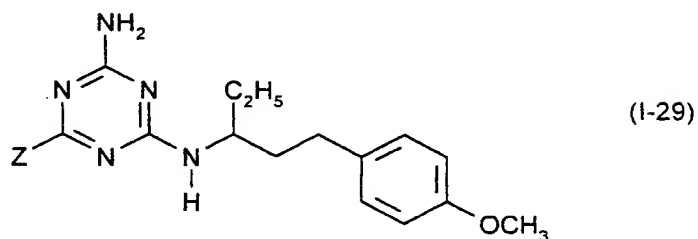
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 28



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

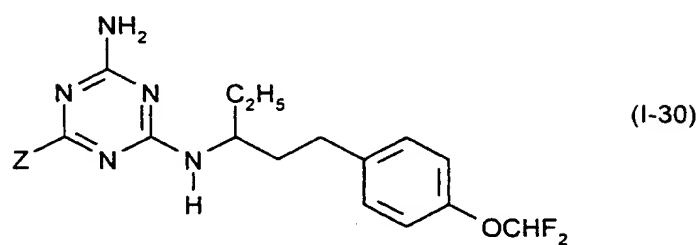
Group 29



Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

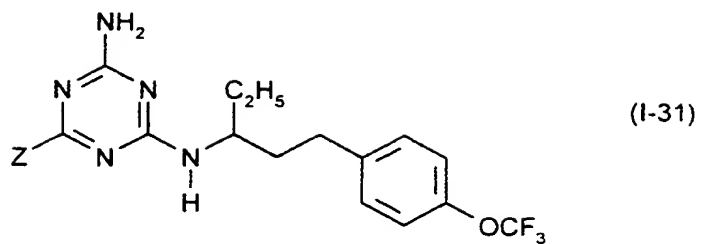
10

Group 30



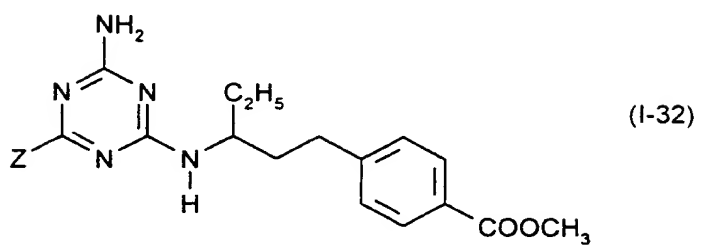
15 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 31



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

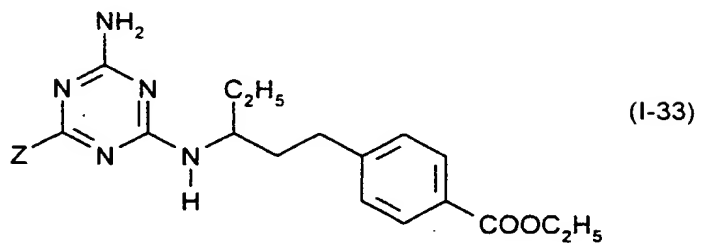
Group 32



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

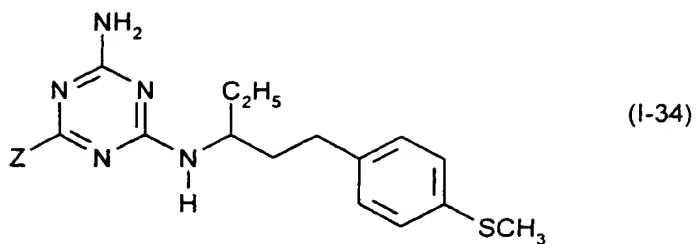
Group 33



15

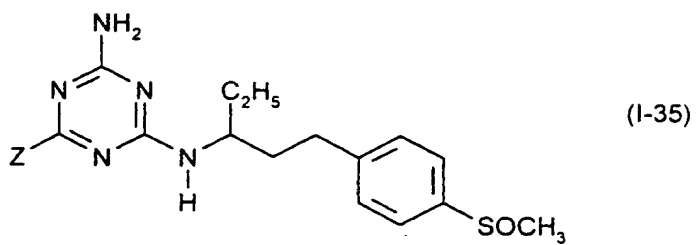
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 34



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

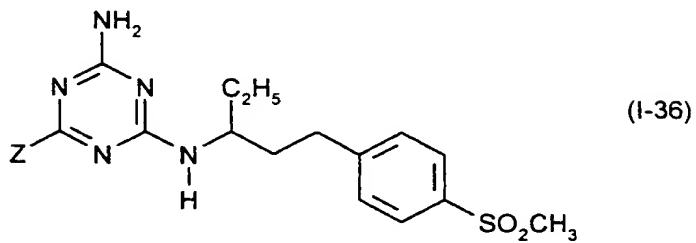
Group 35



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

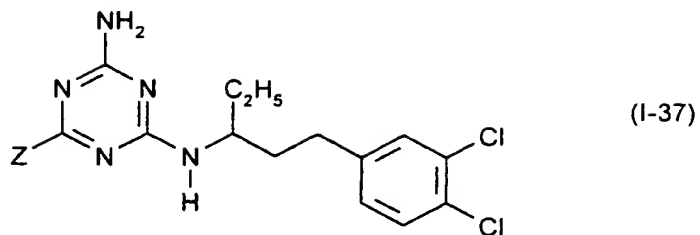
Group 36



15

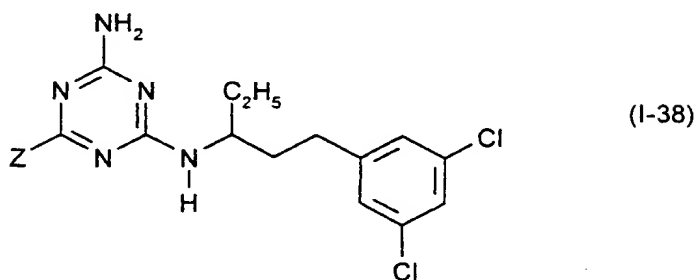
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 37



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

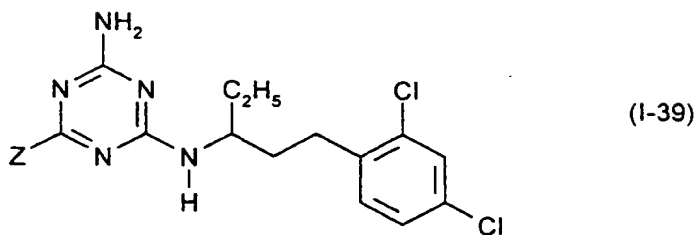
Group 38



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

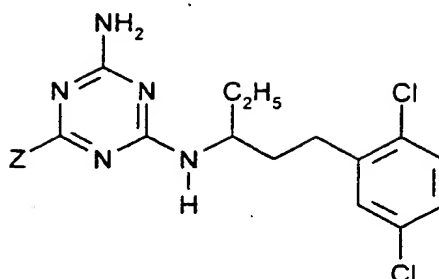
Group 39



15

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

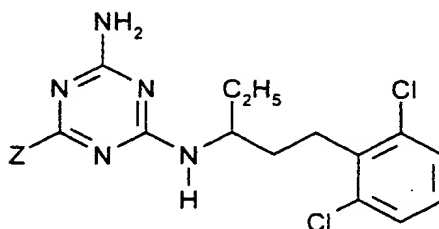
Group 40



(I-40)

5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 41

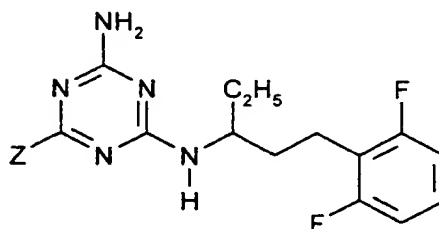


(I-41)

10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 42

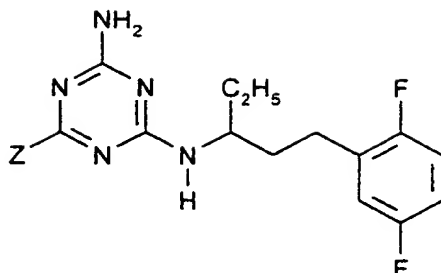


(I-42)

15

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

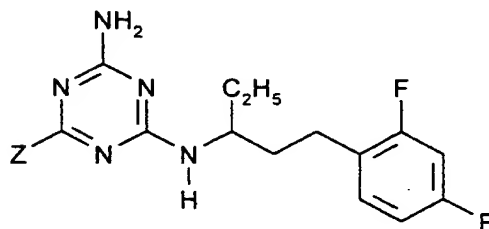
Group 43



(I-43)

5 Here,  $\text{Z}$  has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 44

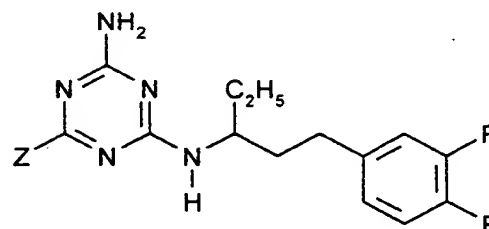


(I-44)

10

Here,  $\text{Z}$  has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 45



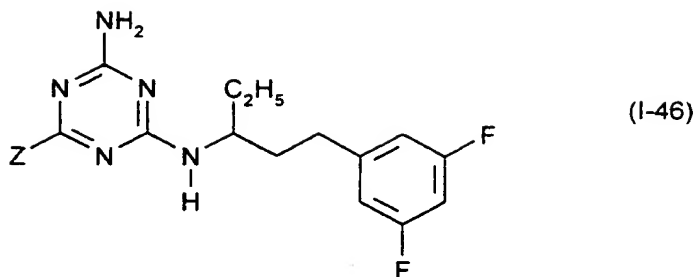
(I-45)

15

Here,  $\text{Z}$  has, for example, the meanings given above in group 1.

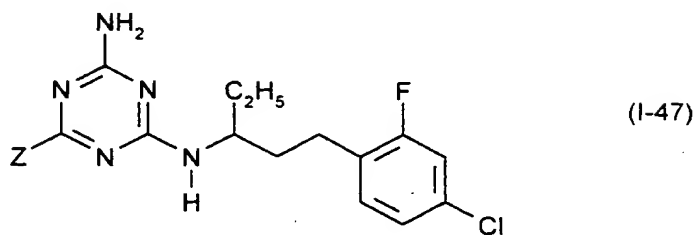


Group 46



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

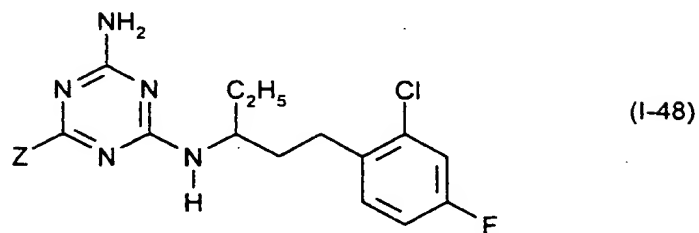
Group 47



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

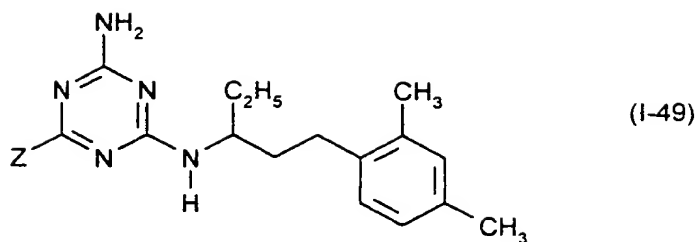
Group 48



15

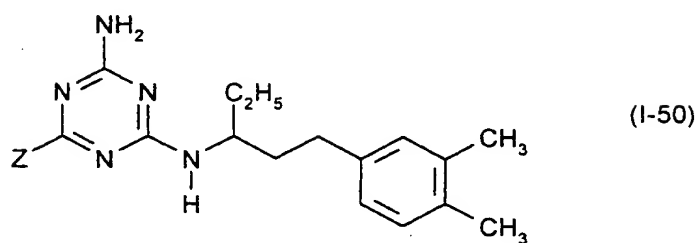
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 49



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

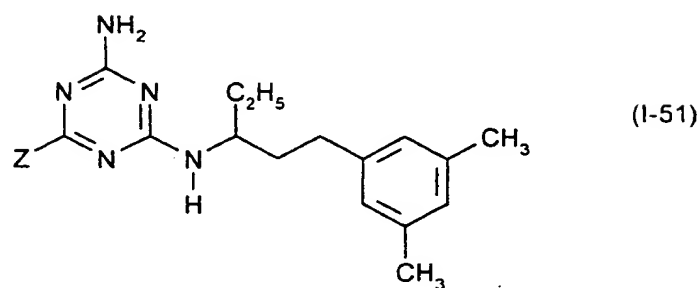
Group 50



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

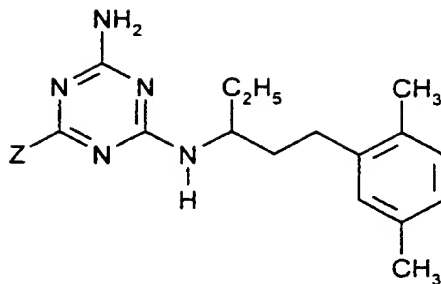
Group 51



15

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

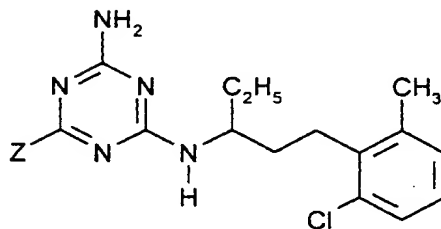
Group 52



(I-52)

5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 53

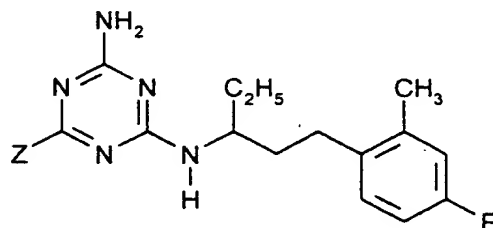


(I-53)

10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 54

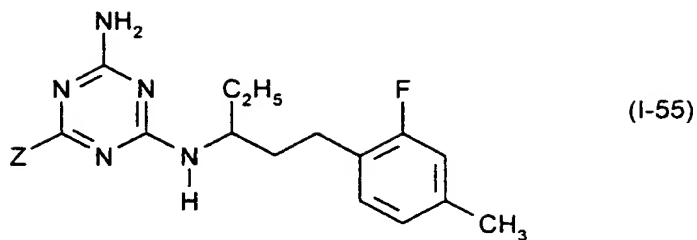


(I-54)

15

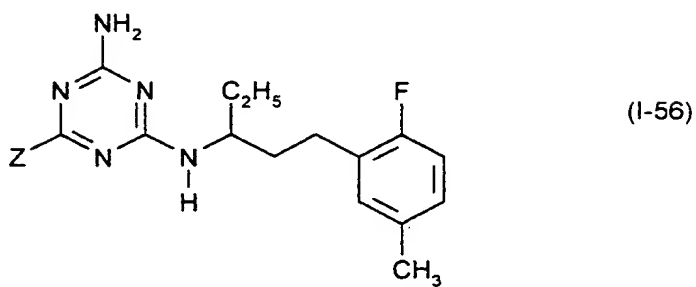
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 55



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

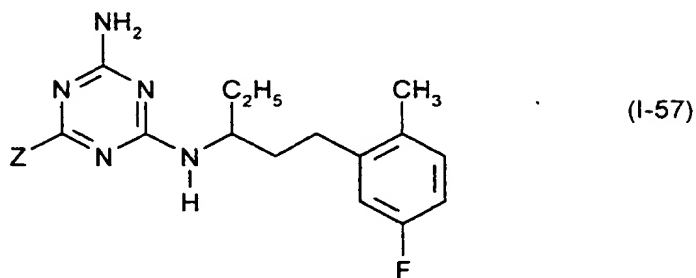
Group 56



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

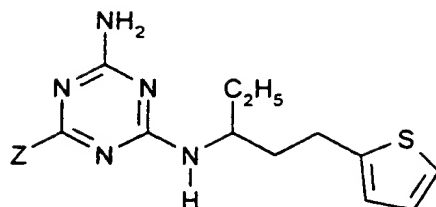
Group 57



15

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

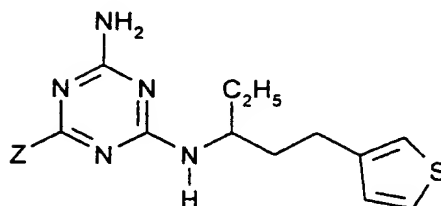
Group 58



(I-58)

5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 59

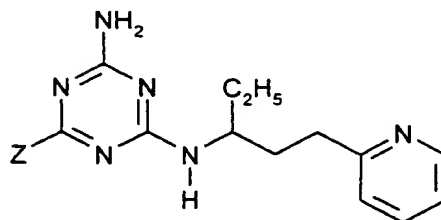


(I-59)

10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 60

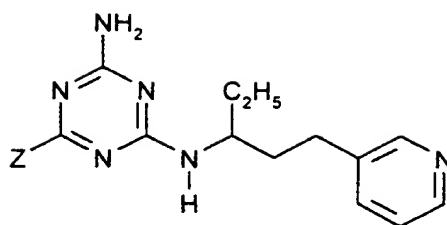


(I-60)

15

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

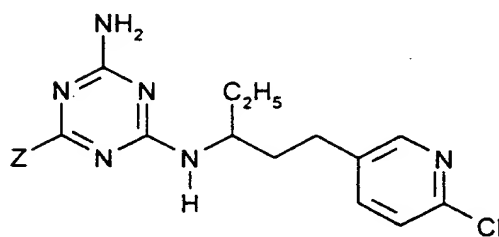
Group 61



(I-61)

5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 62

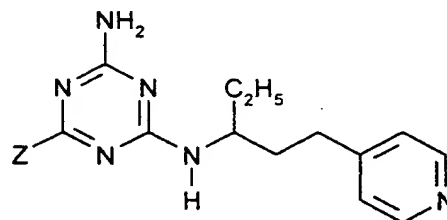


(I-62)

10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 63

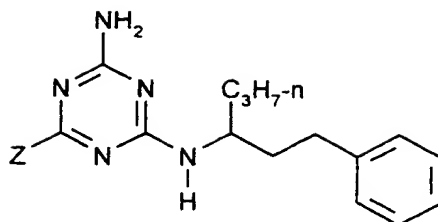


(I-63)

15

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

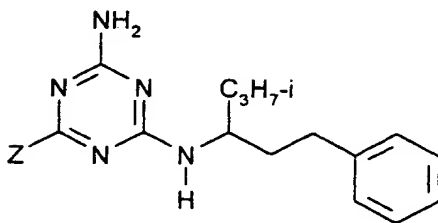
Group 64



(I-64)

5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 65

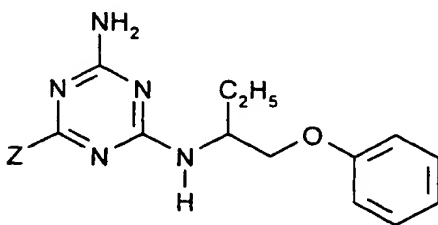


(I-65)

10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 66

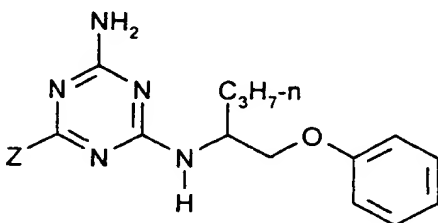


(I-66)

15

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 67



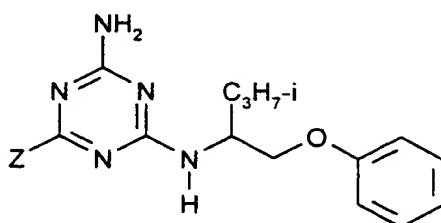
(I-67)

20

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 68

5

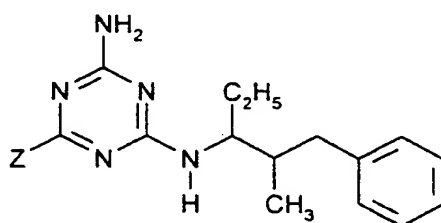


(I-68)

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 69

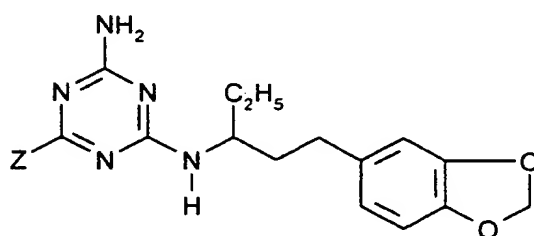
10



(I-69)

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

15 Group 70

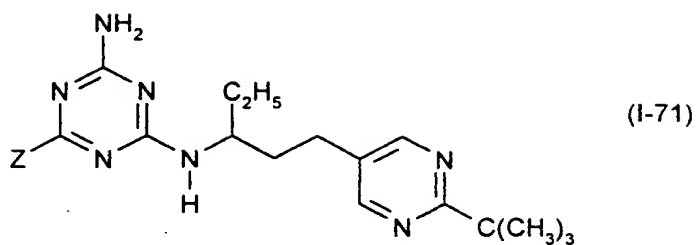


(I-70)

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

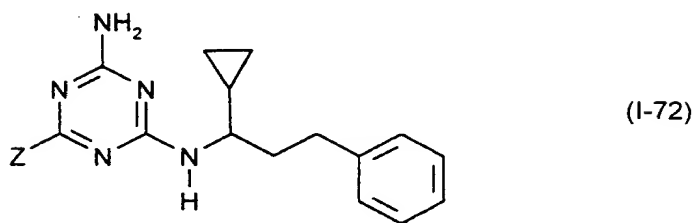


Group 71



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

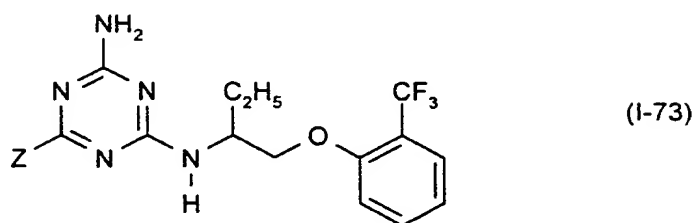
Group 72



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

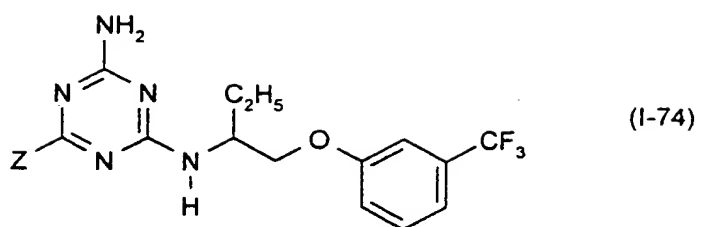
Group 73



15

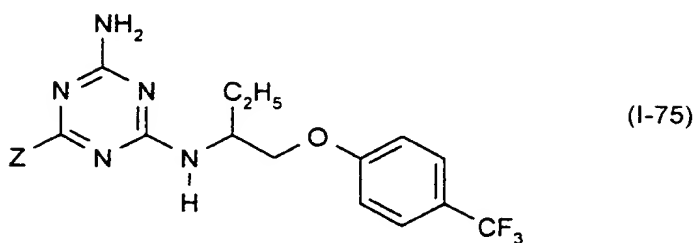
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 74



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

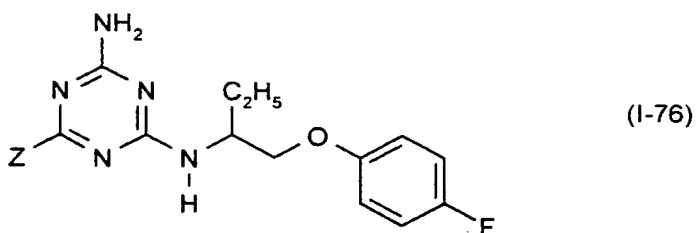
Group 75



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

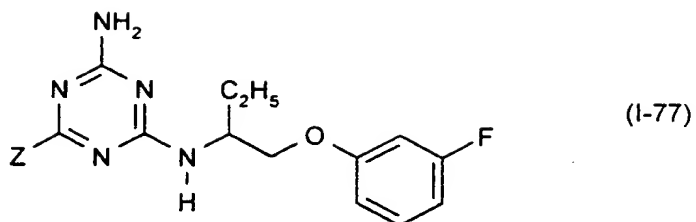
Group 76



15

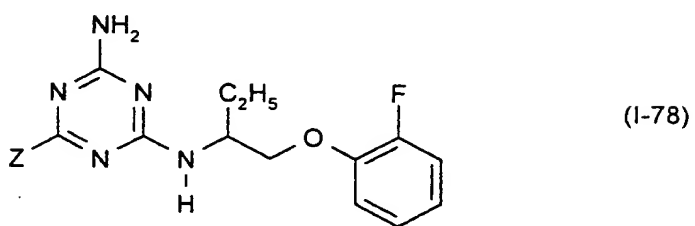
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 77



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

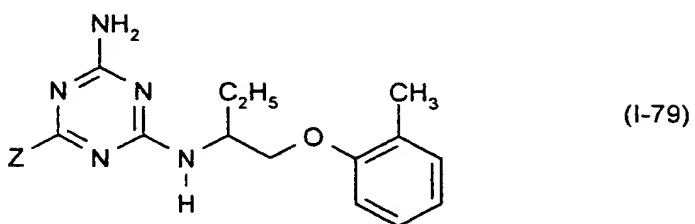
Group 78



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

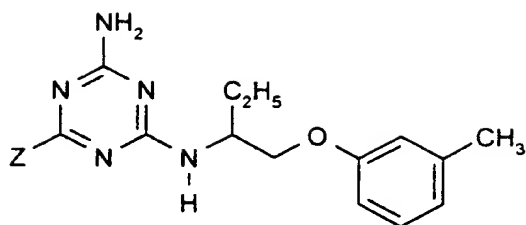
Group 79



15

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

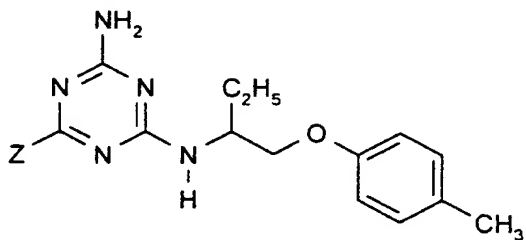
Group 80



(I-80)

- 5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

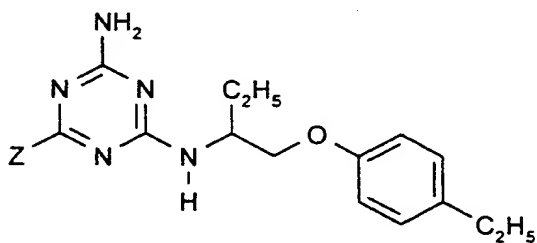
Group 81



(I-81)

- 10 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 82

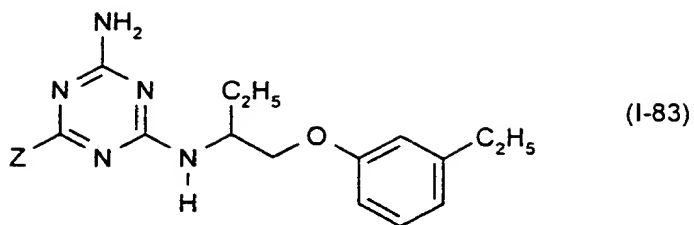


(I-82)

15

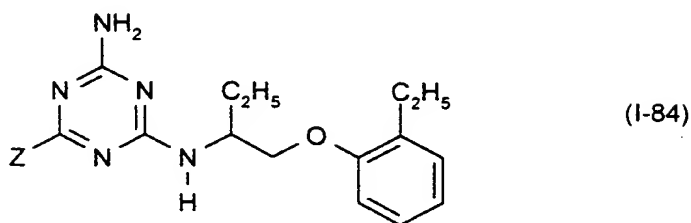
- Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 83



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

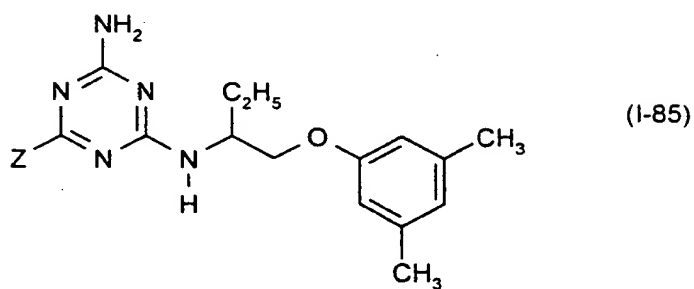
Group 84



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

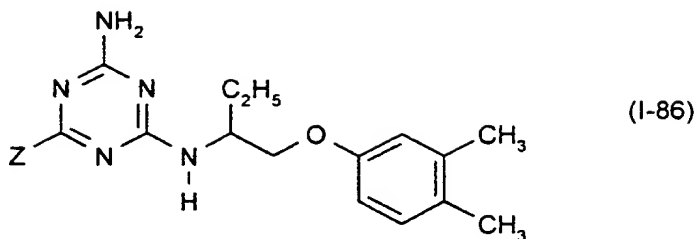
Group 85



15

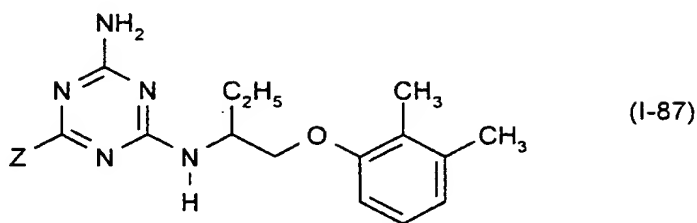
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 86



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

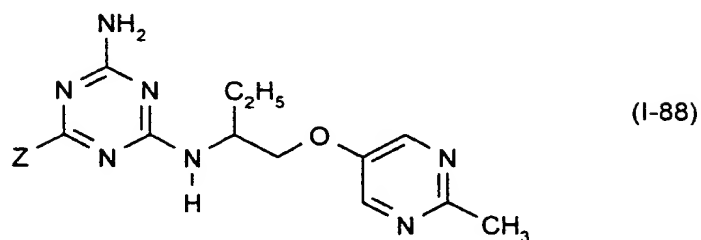
Group 87



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

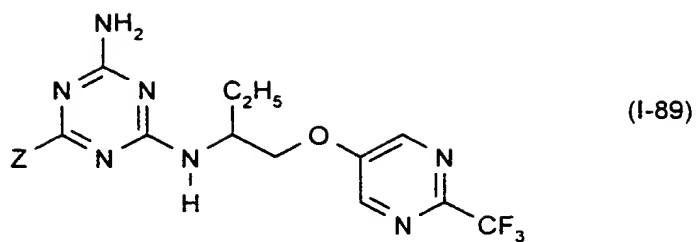
Group 88



15

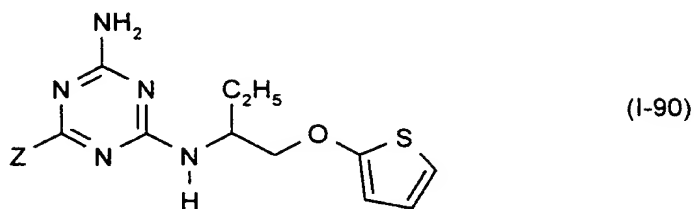
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 89



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

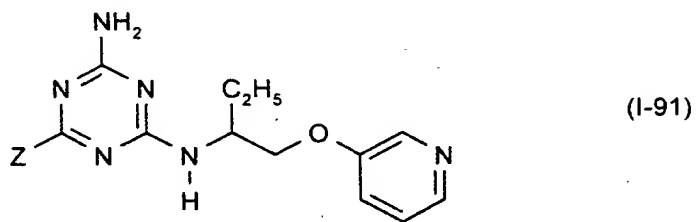
Group 90



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

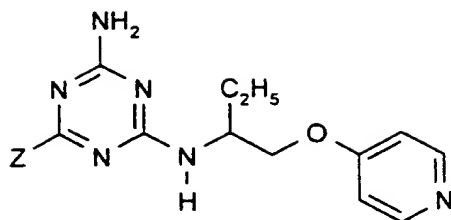
Group 91



15

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

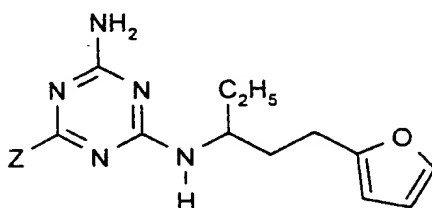
Group 92



(I-92)

5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 93

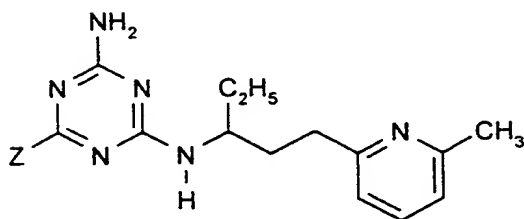


(I-93)

10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 94



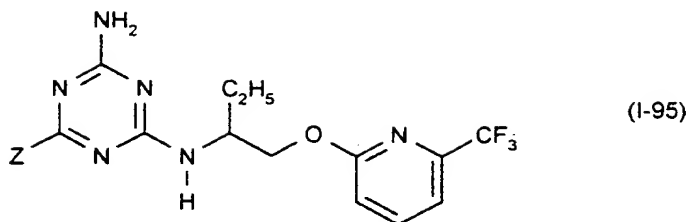
(I-94)

15

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

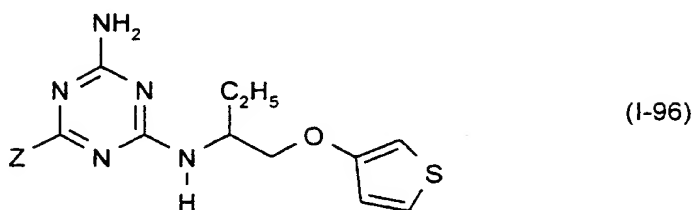


Group 95



5 Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

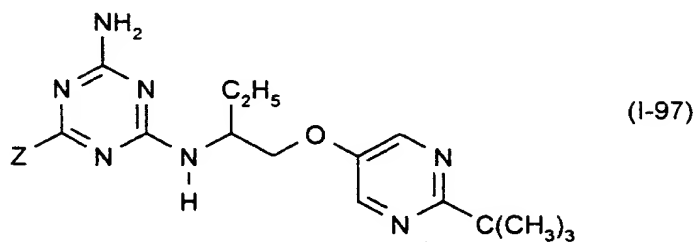
Group 96



10

Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

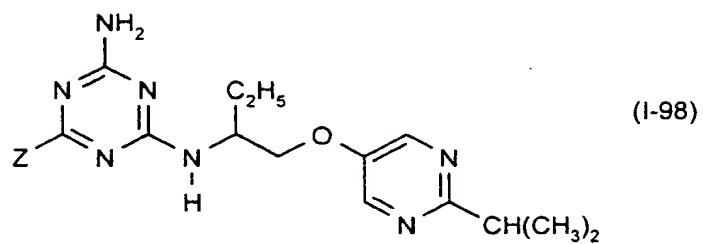
Group 97



15

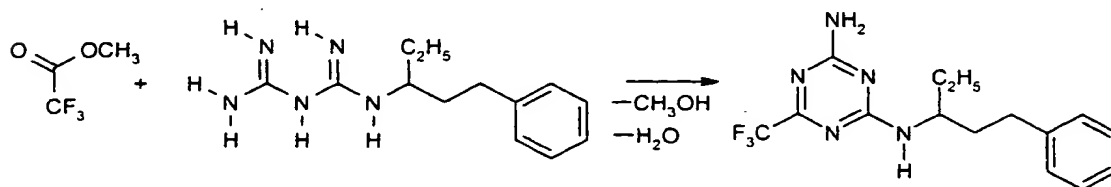
Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Group 98



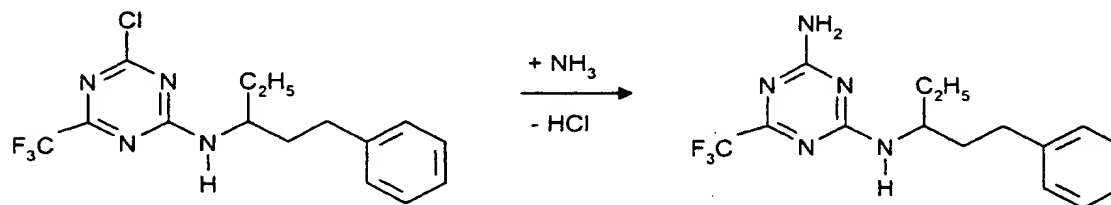
5      Here, Z has, for example, the meanings given above in group 1.

Using, for example, 1-(1-ethyl-3-phenyl-propyl)-biguanide and methyl trifluoroacetate as starting materials, the course of the reaction in the process (a) according to the invention can be illustrated by the following equation:



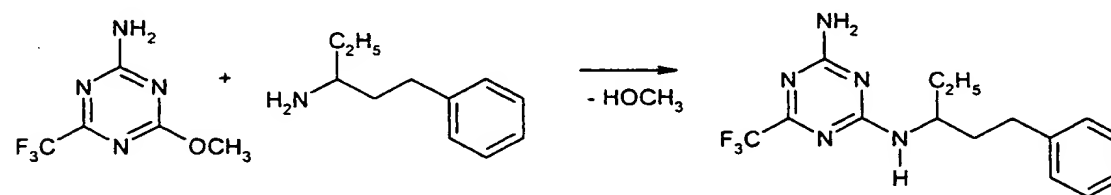
5

Using, for example, 2-chloro-4-(1-ethyl-3-phenyl-propylamino)-6-trifluoromethyl-1,3,5-triazine and ammonia as starting materials, the course of the reaction in the process (b) according to the invention can be illustrated by the following equation:



10

Using, for example, 2-amino-4-methoxy-6-trifluoromethyl-1,3,5-triazine and 3-phenyl-1-ethyl-propylamine as starting materials, the course of the reaction in the process (c) according to the invention can be illustrated by the following equation:



15

The formula (II) provides a general definition of the substituted biguanides to be used as starting materials in the process (a) according to the invention for preparing compounds of the formula (I). In the formula (II), R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A and Ar each preferably or in particular have those meanings which have already been mentioned above, in

20

connection with the description of the compounds of the formula (I) according to the invention, as being preferred or as being particularly preferred for R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A and Ar. Examples of the substituted biguanides of the formula (II) which may be mentioned are:

5

10

15

20

25

30

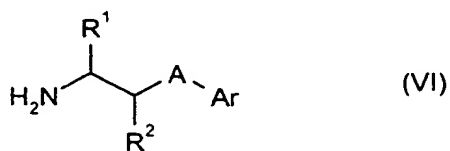
1-(1-ethyl-3-phenyl-propyl)-, 1-(1-n-propyl-3-phenyl-propyl)-, 1-(1-i-propyl-3-phenyl-propyl)-, 1-(1-cyclopropyl-3-phenyl-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-fluoro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(3-fluoro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-fluoro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-chloro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(3-chloro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-chloro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-bromo-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(3-bromo-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-bromo-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-trifluoromethyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-trifluoromethoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-methylsulphinyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-methylsulphinyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-methylsulphonyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-methylsulphonyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(3,4-dichloro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2,4-dichloro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2,5-dichloro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2,6-dichloro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2,6-difluoro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2,5-difluoro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2,4-difluoro-phenyl)-propyl)-,

1-(1-ethyl-3-(3,4-difluoro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(3,5-difluoro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-chloro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-chloro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-chloro-6-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(2-fluoro-5-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-(5-fluoro-2-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-thien-2-yl-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-thien-3-yl-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-pyridin-2-yl-propyl)-, 1-(1-ethyl-3-pyridin-3-yl-propyl)- and 1-(1-ethyl-3-pyridin-4-yl-propyl)-biguanide.

Suitable acid adducts of compounds of the formula (II) are their addition products with protic acids, such as, for example with hydrogen chloride, hydrogen bromide, sulphuric acid, methanesulphonic acid, benzenesulphonic acid and p-toluenesulphonic acid.

The starting materials of the general formula (II) have hitherto not been disclosed in the literature; as novel substances, they also form part of the subject matter of the present application.

The novel substituted biguanides of the general formula (II) are obtained when substituted alkylamines of the general formula (VI),



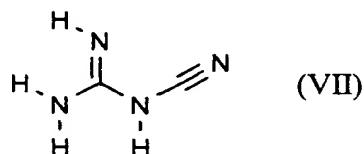
in which

$\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ , A and Ar are each as defined above

- and/or acid adducts of compounds of the general formula (VI), such as, for example, the hydrochlorides -

are reacted with cyanoguanidine ("dicyanodiamide") of the formula (VII)

5



if appropriate in the presence of a reaction auxiliary, such as, for example, hydrogen chloride, and if appropriate in the presence of a diluent, such as, for example, n-decane or 1,2-dichloro-benzene, at temperatures between 100°C and 200°C (cf. EP 492615, Preparation Examples).

The substituted alkylamino compounds of the general formula (VI) required as precursors for this purpose are known and/or can be prepared by processes known per se (cf. J. Med. Chem. 10 (1967); 717-724; J. Am. Chem. Soc. 97 (1975), 6900-6901; Tetrahedron Lett. 35 (1994), 3745-3746; DE 3222152; DE 3221540; EP 355351; EP 601486; Preparation Examples).

The formula (III) provides a general definition of the alkoxycarbonyl compounds further to be used as starting materials in the process (a) according to the invention for preparing compounds of the formula (I). In the formula (III), Z preferably or in particular has that meaning which has already been mentioned above, in connection with the description of the compounds of the formula (I) according to the invention, as being preferred or as being particularly preferred for Z; R' preferably represents alkyl having 1 to 4 carbon atoms, and in particular represents methyl or ethyl.

The starting materials of the formula (III) are known chemicals for synthesis.

The formula (IV) provides a general definition of the substituted triazines to be used as starting materials in the process (b) according to the invention for preparing

5

10

15

20

25

30

ethyl-3-(2-methylsulphinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(5-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- and 2-(1-ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- - 4,6-dichloro-1,3,5-triazine;

2-(1-ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-



ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoro-  
methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-tri-  
5 fluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethoxy-phenyl)-  
propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-  
3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylthio-  
10 phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-  
ethyl-3-(2-methylsulphinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphinyl-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(4-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dichloro-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-  
15 3-(2,5-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-dichloro-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-di-  
fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(3,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-difluoro-phenyl)-  
propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-  
20 (4-fluoro-2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-  
propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-  
dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-,  
2-(1-ethyl-3-(2-chloro-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-  
methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-methyl-phenyl)-propyl-  
25 amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(5-  
fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-  
ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-  
ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- and 2-(1-ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- 4-  
chloro-6-methyl-1,3,5-triazine;

2-(1-ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(3-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-chloro-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-  
5 (2-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(4-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-  
propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-  
methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-  
10 ethyl-3-(2-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethyl-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-  
ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoro-  
methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propyl-  
15 amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-tri-  
fluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethoxy-phenyl)-  
propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-  
3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-  
20 (1-ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylthio-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-  
ethyl-3-(2-methylsulphinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphinyl-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(4-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dichloro-  
25 phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-  
3-(2,5-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-dichloro-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-di-  
fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(3,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-difluoro-phenyl)-  
30 propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-  
(4-fluoro-2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-

propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-6-methylphenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(5-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- and 2-(1-ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- 4-chloro-6-trifluoromethyl-1,3,5-triazine;

2-(1-ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-

ethyl-3-(2-methylsulphinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-6-methylphenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(5-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- and 2-(1-ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- 4-chloro-6-(1-fluoro-ethyl)-1,3,5-triazine;

2-(1-ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-

ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoro-  
methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-tri-  
5 fluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethoxy-phenyl)-  
propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-  
3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylthio-  
10 phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-  
ethyl-3-(2-methylsulphinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphinyl-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(4-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dichloro-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-  
15 3-(2,5-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-dichloro-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-di-  
fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(3,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-difluoro-phenyl)-  
propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-  
20 (4-fluoro-2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-  
propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-  
dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-,  
2-(1-ethyl-3-(2-chloro-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-  
methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-methyl-phenyl)-propyl-  
25 amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(5-  
fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-  
ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-  
ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- and 2-(1-ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- -  
4-chloro-6-(1-fluoro-1-methyl-ethyl)-1,3,5-triazine;

2-(1-ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylsulphinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-

propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(5-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- and 2-(1-ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- 4-chloro-6-methoxy-1,3,5-triazine;

2-(1-ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-

ethyl-3-(2-methylsulphanyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphanyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-6-methylphenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(5-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- and 2-(1-ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- 4-chloro-6-(2,2,2-trifluoro-ethoxy)-1,3,5-triazine;

2-(1-ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-



ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propyl-  
 amino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoro-  
 methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propyl-  
 amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-tri-  
 5 fluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethoxy-phenyl)-  
 propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-  
 3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-  
 phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-  
 (1-ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylthio-  
 10 phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-  
 ethyl-3-(2-methylsulphinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphinyl-  
 phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-  
 (1-ethyl-3-(4-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dichloro-  
 phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-  
 15 3-(2,5-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-dichloro-phenyl)-propyl-  
 amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-di-  
 fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-  
 (1-ethyl-3-(3,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-difluoro-phenyl)-  
 propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-  
 20 (4-fluoro-2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-  
 propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-  
 dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-,  
 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-6-methylphenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-  
 methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-methyl-phenyl)-propyl-  
 25 amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(5-  
 fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-  
 ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-  
 ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- and 2-(1-ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- -4-  
 chloro-6-methylthio-1,3,5-triazine;

2-(1-ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(3-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-chloro-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-  
5 (2-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(4-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-  
propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-  
methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-  
10 ethyl-3-(2-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethyl-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-  
ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoro-  
methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propyl-  
15 amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-tri-  
fluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethoxy-phenyl)-  
propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-  
3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-  
20 (1-ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylthio-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-  
ethyl-3-(2-methylsulphinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphinyl-  
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(4-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dichloro-  
25 phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-  
3-(2,5-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-dichloro-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-di-  
fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-ethyl-3-(3,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-difluoro-phenyl)-  
30 propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-  
(4-fluoro-2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-

propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-6-methylphenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(5-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- and 2-(1-ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- 4-chloro-6-methylsulphinyl-1,3,5-triazine;

2-(1-ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-bromo-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-ethyl-3-(3-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-

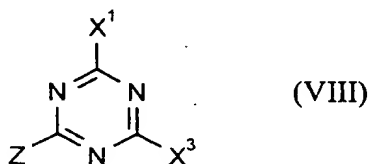
ethyl-3-(2-methylsulphinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-methylsulphonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-dichloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,6-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-difluoro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-chloro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-chloro-6-methylphenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(4-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(2-fluoro-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-(5-fluoro-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- and 2-(1-ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- 4-chloro-6-methylsulphonyl-1,3,5-triazine.

20

The starting materials of the general formula (IV) have hitherto not been disclosed in the literature; as novel substances, they also form part of the subject-matter of the present application.

25

The novel substituted triazines of the general formula (IV) are obtained when triazines of the general formula (VIII)



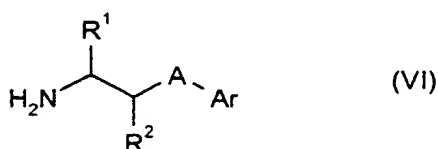
in which

$X^1$  and Z are each as defined above and

$X^3$  represents halogen

5

are reacted with substituted alkylamines of the general formula (VI)



10

in which

$R^1$ ,  $R^2$ , A and Ar are each as defined above,

15

if appropriate in the presence of an acid acceptor, such as, for example, ethyldiisopropylamine, and if appropriate in the presence of a diluent, such as, for example, tetrahydrofuran or dioxane, at temperatures between  $-50^\circ\text{C}$  and  $+50^\circ\text{C}$  (cf. the Preparation Examples).

20

The formula (V) provides a general definition of the substituted triazines to be used as starting materials in the process (c) according to the invention for preparing compounds of the formula (I). In the formula (V), Z preferably or in particular has that meaning which has already been mentioned above, in connection with the description of the compounds of the formula (I) according to the invention, as being preferred or as being particularly preferred for that;  $X^2$  preferably represents fluorine, chlorine, bromine, methoxy or ethoxy, and in particular represents chlorine or methoxy.

25

The starting materials of the general formula (V) are known and/or can be prepared by processes known per se (cf. WO 95/11237).

The formula (VI) provides a general definition of the substituted alkylamines further to be used as starting materials in the process (c) according to the invention. In the formula (VI), R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A and Ar each preferably or in particular have those meanings which have already been mentioned above, in connection with the description of the compounds of the formula (IV) according to the invention, as being preferred or as being particularly preferred for R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A and Ar.

The starting materials of the general formula (VI) are known and/or can be prepared by processes known per se (cf. DE 3426919; DE 4000610; DE 4332738, EP 320898; EP 443606; Tetrahedron: Asymmetry 5 (1994), 817-820; Tetrahedron Lett. 29 (1988), 223-224; loc. cit. 36 (1995), 3917-3920; Preparation Examples).

If appropriate, the processes according to the invention for preparing the compounds of the formula (I) are carried out using a reaction auxiliary. Suitable reaction auxiliaries for the processes (a), (b) and (c) are, in general, the customary inorganic or organic bases or acid acceptors. These preferably include alkali metal or alkaline earth metal acetates, amides, carbonates, bicarbonates, hydrides, hydroxides or alkoxides, such as, for example, sodium acetate, potassium acetate or calcium acetate, lithium amide, sodium amide, potassium amide or calcium amide, sodium carbonate, potassium carbonate or calcium carbonate, sodium bicarbonate, potassium bicarbonate or calcium bicarbonate, lithium hydride, sodium hydride, potassium hydride or calcium hydride, lithium hydroxide, sodium hydroxide, potassium hydroxide or calcium hydroxide, sodium methoxide, ethoxide, n- or i-propoxide, n-, i-, s- or t-butoxide or potassium methoxide, ethoxide, n- or i-propoxide, n-, i-, s- or t-butoxide; furthermore also basic organic nitrogen compounds, such as, for example, trimethylamine, triethylamine, tripropylamine, tributylamine, ethyl-diisopropylamine, N,N-dimethyl-cyclohexylamine, dicyclohexylamine, ethyl-dicyclohexylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, pyridine, 2-methyl-, 3-methyl-, 4-ethyl-, 2,4-dimethyl-, 2,6-dimethyl-, 3,4-dimethyl- and 3,5-dimethyl-pyridine, 5-ethyl-2-methyl-pyridine, 4-dimethylamino-pyridine, N-methyl-piperidine, 1,4-diazabicyclo-

[2,2,2]-octane (DABCO), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]-non-5-ene (DBN), or 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-ene (DBU).

5 Suitable diluents for carrying out the processes (a), (b) and (c) according to the invention are especially inert organic solvents. These include in particular aliphatic, alicyclic or aromatic, optionally halogenated hydrocarbons, such as, for example, benzene, toluene, xylene, chlorobenzene, dichlorobenzene, petroleum ether, hexane, cyclohexane, dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride; ethers, such as diethyl ether, diisopropyl ether, dioxane, tetrahydrofuran or ethylene glycol dimethyl or diethyl ether; ketones, such as methyl isopropyl ketone or methyl isobutyl ketone; nitriles, such as acetonitrile, propionitrile or butyronitrile; amides, such as N,N-dimethylformamide, N,N-dimethylacetamide, N-methyl-formanilide, N-methyl-pyrrolidone or hexamethylphosphoric triamide; esters, such as methyl acetate or ethyl acetate, sulphoxides, such as dimethyl sulphoxide; alcohols, such as methanol, ethanol, n- or i-propanol, ethylene glycol monomethyl ether, ethylene glycol monoethyl ether, diethylene glycol monomethyl ether, diethylene glycol monoethyl ether, mixtures thereof with water or pure water.

20 In the practice of the processes (a), (b) and (c) according to the invention, the reaction temperatures can be varied over a relatively wide range. Generally, the reaction is carried out at temperatures between 0°C and 300°C, preferably between 10°C and 250°C.

25 The processes (a), (b) and (c) according to the invention are generally carried out at atmospheric pressure. However, it is also possible to carry out the processes according to the invention under elevated or reduced pressure - generally between 0.1 bar and 10 bar.

30 In the practice of the processes according to the invention, the starting materials are generally employed in approximately equimolar amounts. However, it is also possible to use a relatively large excess of one of the components. The reaction is generally

carried out in a suitable diluent in the presence of a reaction auxiliary, and the reaction mixture is generally stirred for several hours at the temperature required. Work-up is carried out by conventional methods (cf. the Preparation Examples).

5       The active compounds according to the invention can be used as defoliants, desiccants, haulm killers and, especially, as weed-killers. By weeds in the broadest sense, there are to be understood all plants which grow in locations where they are undesirable. Whether the substances according to the invention act as total or selective herbicides depends essentially on the amount used.

10

The active compounds according to the invention can be used, for example, in connection with the following plants:

15       Dicotyledonous weeds of the genera: Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus and Taraxacum.

20       Dicotyledonous crops of the genera: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis and Cucurbita.

25       Monocotyledonous weeds of the genera: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera and Phalaris.

30       Monocotyledonous crops of the genera: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus and Allium.



However, the use of the active compounds according to the invention is in no way restricted to these genera, but also extends in the same manner to other plants.

5       The compounds are suitable, depending on the concentration, for the total control of weeds, for example on industrial terrain and railway tracks, and on paths and squares with or without tree plantings. Equally, the compounds can be employed for controlling weeds in perennial cultures, for example forests, decorative tree plantings, orchards, vineyards, citrus groves, nut orchards, banana plantations, coffee plantations, tea  
10       plantations, rubber plantations, oil palm plantations, cocoa plantations, soft fruit plantings and hopfields, on lawns, turf and pasture land, and for the selective control of weeds in annual cultures.

15       The compounds of the formula (I) according to the invention are suitable in particular for selectively controlling monocotyledonous and dicotyledonous weeds in monocotyledonous and dikotyledonous crops, both pre-emergence and post-emergence. The active compounds can be converted into the customary formulations, such as solutions, emulsions, wettable powders, suspensions, powders, dusting agents, pastes, soluble powders, granules, suspo-emulsion concentrates, natural and synthetic materials  
20       impregnated with active compound, and very fine capsules in polymeric substances.

25       These formulations are produced in a known manner, for example by mixing the active compounds with extenders, that is liquid solvents and/or solid carriers, optionally with the use of surfactants, that is emulsifiers and/or dispersing agents and/or foam-forming agents.

30       If the extender used is water, it is also possible to employ for example organic solvents as auxiliary solvents. Essentially, suitable liquid solvents are: aromatics, such as xylene, toluene or alkylnaphthalenes, chlorinated aromatics and chlorinated aliphatic hydrocarbons, such as chlorobenzenes, chloroethylenes or methylene chloride, aliphatic hydrocarbons, such as cyclohexane or paraffins, for example petroleum fractions,

mineral and vegetable oils, alcohols, such as butanol or glycol and also their ethers and esters, ketones, such as acetone, methyl ethyl ketone, methyl isobutyl ketone or cyclohexanone, strongly polar solvents, such as dimethylformamide and dimethyl sulphoxide, and also water.

5

Suitable solid carriers are: for example ammonium salts and ground natural minerals, such as kaolins, clays, talc, chalk, quartz, attapulgite, montmorillonite or diatomaceous earth, and ground synthetic minerals, such as finely divided silica, alumina and silicates; suitable solid carriers for granules are: for example crushed and fractionated  
10 natural rocks such as calcite, marble, pumice, sepiolite and dolomite, and also synthetic granules of inorganic and organic meals, and granules of organic material such as sawdust, coconut shells, maize cobs and tobacco stalks; suitable emulsifiers and/or foam-forming agents are: for example nonionic and anionic emulsifiers, such as polyoxyethylene fatty acid esters, polyoxyethylene fatty alcohol ethers, for example  
15 alkylaryl polyglycol ethers, alkylsulphonates, alkyl sulphates, arylsulphonates and also protein hydrolysates; suitable dispersing agents are: for example lignin-sulphite waste liquors and methylcellulose.

Tackifiers such as carboxymethylcellulose and natural and synthetic polymers in the  
20 form of powders, granules or latexes, such as gum arabic, polyvinyl alcohol and polyvinyl acetate, as well as natural phospholipids, such as cephalins and lecithins, and synthetic phospholipids, can be used in the formulations. Other possible additives are mineral and vegetable oils.

25 It is possible to use colorants such as inorganic pigments, for example iron oxide, titanium oxide and Prussian Blue, and organic dyes, such as alizarin dyes, azo dyes and metal phthalocyanine dyes, and trace nutrients such as salts of iron, manganese, boron, copper, cobalt, molybdenum and zinc.

30 The formulations in general contain between 0.1 and 95 per cent by weight of active compound, preferably between 0.5 and 90%.

For controlling weeds, the active compounds according to the invention, as such or in the form of their formulations, can also be used as mixtures with known herbicides, finished formulations or tank mixes being possible.

5

Possible components for the mixtures are known herbicides, for example acetochlor, acifluorfen(-sodium), aclonifen, alachlor, alloxydim(-sodium), ametryne, amidochlor, amidosulfuron, asulam, atrazine, azimsulfuron, benazolin, benfuresate, bensulfuron(-methyl), bentazon, benzofenap, benzoylprop(-ethyl), bialaphos, bifenox, bromobutide, bromofenoxim, bromoxynil, butachlor, butylate, cafenstrole, carbetamide, chlomethoxyfen, chloramben, chloridazon, chlorimuron(-ethyl), chlornitrofen, chlorsulfuron, chlortoluron, cinmethylin, cinosulfuron, clethodim, clodinafop(-propargyl), clomazone, clopyralid, clopyrasulfuron, cloransulam(-methyl), cumyluron, cyanazine, cycloate, cyclosulfamuron, cycloxydim, cyhalofop(-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, desmedipham, diallate, dicamba, diclofop(-methyl), difenzoquat, diflufenican, dimefuron, dimepiperate, dimethachlor, dimethametryn, dimethenamid, dinitramine, diphenamid, diquat, dithiopyr, diuron, dymron, EPTC, esprocarb, ethalfluralin, ethametsulfuron(-methyl), ethofumesate, ethoxyfen, etobenzanid, fenoxaprop-ethyl, flamprop(-isopropyl), flamprop(-isopropyl-L), flamprop(-methyl), flazasulfuron, fluazifop(-butyl), flumetsulam, flumiclorac(-pentyl), flumioxazin, flumipropyn, fluometuron, fluorochloridone, fluoroglycofen(-ethyl), flupoxam, flupropacil, flurenol, fluridone, fluroxypyr, flurprimidol, flurtamone, fomesafen, glufosinate(-ammonium), glyphosate(-isopropylammonium), halosafen, haloxyfop(-ethoxyethyl), hexazinone, imazamethabenz(-methyl), imazamethapyr, imazamox, imazapyr, imazaquin, imazethapyr, imazosulfuron, ioxynil, isopropalin, isoproturon, isoxaben, isoxaflutole, isoxapyrifop, lactofen, lenacil, linuron, MCPA, MCPP, mefenacet, metamitron, metazachlor, methabenzthiazuron, metobenzuron, metobromuron, metolachlor, metosulam, metoxuron, metribuzin, metsulfuron(-methyl), molinate, monolinuron, naproanilide, napropamide, neburon, nicosulfuron, norflurazon, orbencarb, oryzalin, oxadiazon, oxyfluorfen, paraquat, pendimethalin, phenmedipham, piperophos, pretilachlor, primisulfuron(-methyl), prometryn,

10  
15  
20  
25  
30

propachlor, propanil, propaquizafop, propyzamide, prosulfocarb, prosulfuron, pyrazolate, pyrazosulfuron(-ethyl), pyrazoxyfen, pyributicarb, pyridate, pyrithiobac(-sodium) quinchlorac, quinmerac, quizalofop(-ethyl), quizalofop(-p-tefuryl), rimsulfuron, sethoxydim, simazine, simetryn, sulcotrione, sulfentrazone, 5 sulfometuron(-methyl), sulfosate, tebutam, tebuthiuron, terbuthylazine, terbutryn, thenylchlor, thiafluamide, thiazopyr, thidiazimin, thifensulfuron(-methyl), thiobencarb, tiocarbazil, tralkoxydim, triallate, triasulfuron, tribenuron(-methyl), triclopyr, tridiphane, trifluralin and triflusulfuron.

10 Mixtures with other known active compounds, such as fungicides, insecticides, acaricides, nematocides, bird repellents, plant nutrients and agents which improve soil structure, are also possible.

15 The active compounds can be used as such, in the form of their formulations or in the use forms prepared therefrom by further dilution, such as ready-to-use solutions, suspensions, emulsions, powders, pastes and granules. They are used in the customary manner, for example by watering, spraying, atomizing or scattering.

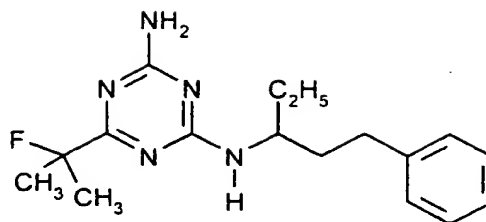
20 The active compounds according to the invention can be applied either before or after emergence of the plants. They can also be incorporated into the soil before sowing.

25 The amount of active compound used can vary within a substantial range. It depends essentially on the nature of the desired effect. In general, the amounts used are between 1 g and 10 kg of active compound per hectare of soil surface, preferably between 5 g and 5 kg per ha.

The preparation and use of the active compounds according to the invention can be seen from the Examples below.

# Preparation Examples:

## Example 1



5 (Process (a))

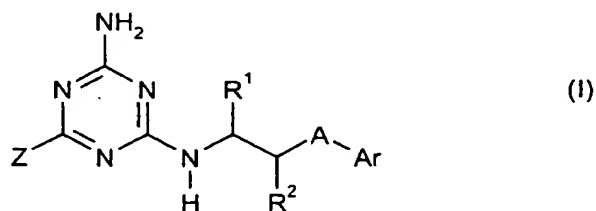
At approximately 22°C, a mixture of 2.0 g (7 mmol) of (R/S)-1-(1-ethyl-3-phenyl-propyl)-biguanide hydrochloride (racemic), 1.89 g (14 mmol) of ethyl 2-fluoro-isobutyrate, 0.76 g (14 mmol) of sodium methoxide and 12 ml of methanol is stirred  
10 for about 15 hours. The mixture is then diluted to about 3 times its original volume using water and shaken with ethyl acetate, and the organic phase is separated off washed with water, dried with sodium sulphate and filtered. The solvent is carefully distilled off from the filtrate under water pump vacuum. The residue is purified by column chromatography (silica gel, ethyl acetate).

15

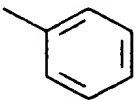
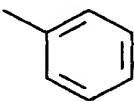
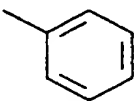
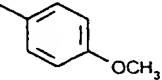
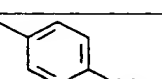
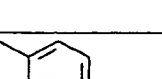
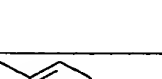
This gives 1.44 g (64% of theory) of (R/S)-2-amino-4-(1-fluoro-1-methyl-ethyl)-6-(1-ethyl-3-phenyl-propylamino)-1,3,5-triazine (racemate).

20

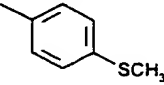
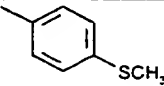
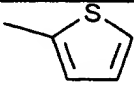
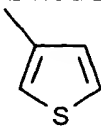
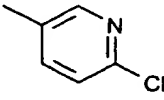
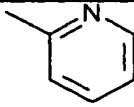
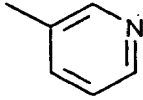
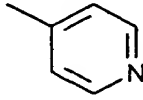
By the method of Example 1 and in accordance with the general description of preparation processes according to the invention, it is also possible to prepare, for example, the compounds of the formula (I) listed in Table 1 below.



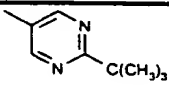
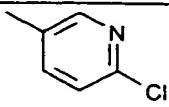
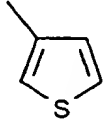
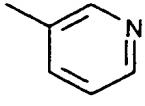
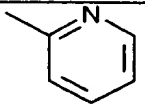
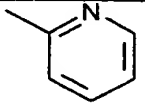
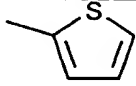
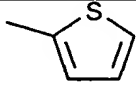
**Table 1:** Examples of compounds of the formula (I)

Ex. No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	A	Ar	Z	Physical data and stereochemical specification
2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	m.p.: 100°C (racemate)
3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (R enantiomer)
4	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (S enantiomer)
5	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(racemate)
6	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(R enantiomer)
7	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(S enantiomer)
8	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorphous) (racemate)

**Table 1** (continued)

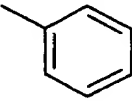
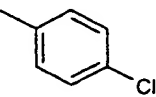
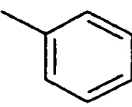
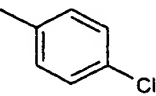
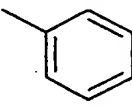
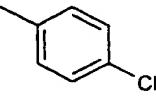
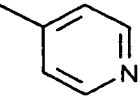
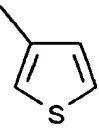
Ex. No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>		Az	Z	Physical data and stereochemical specifications
9	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(R enantiomer)
10	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(S enantiomer)
11	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
12	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
13	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	m.p.: 74°C (racemate)
14	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
15	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
16	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)

**Table 1** (continued)

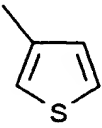
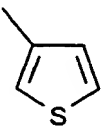
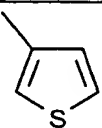
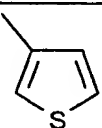
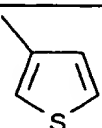
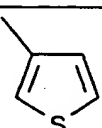
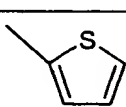
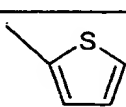
Ex. No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>		Az	Z	Physical data and stereochemical specifications
17	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
18	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHFCH <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
19	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHFCH <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
20	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHFCH <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
21	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHFCH <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
22	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorphous) (racemate)
23	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHFCH <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
24	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorphous) (racemate)



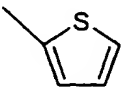
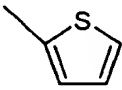
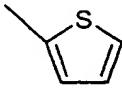
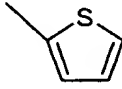
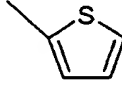
**Table 1** (continued)

Ex. No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>		Az	Z	Physical data and stereochemical specifications
41	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
42	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
43	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (S enantiomer)
44	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (S enantiomer)
45	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (R enantiomer)
46	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	(amorphous) (R enantiomer)
47	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorphous) (racemate)
48	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(amorphous) (racemate)

**Table 1** (continued)

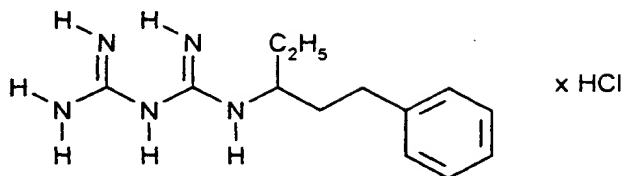
Ex. No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>		Az	Z	Physical data and stereochemical specifications
49	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	(amorphous)  (racemate)
50	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	(amorphous)  (racemate)
51	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHClCH <sub>3</sub>	(amorphous)  (racemate)
52	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHCl <sub>2</sub>	(amorphous)  (racemate)
53	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	(amorphous)  (racemate)
54	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorphous)  (racemate)
55	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	(amorphous)  (racemate)
56	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorphous)  (racemate)

**Table 1** (continued)

Ex. No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>		Az	Z	Physical data and stereochemical specifications
57	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(amorphous) (racemate)
58	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
59	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
60	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHClCH <sub>3</sub>	(amorphous) (racemate)
61	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHCl <sub>2</sub>	(amorphous) (racemate)

Starting materials of the formula (II):

Example (II-1)



5

A mixture of 2.9 g (14.5 mmol) of 1-ethyl-3-phenyl-propylamine hydrochloride (racemic), 1.22 g (14.5 mmol) of cyanoguanidine (dicyandiamide) and 30 ml of 1,2-dichloro-benzene is heated at 140°C to 150°C for 8 hours. The crystalline product which is obtained after cooling is isolated by filtration with suction.

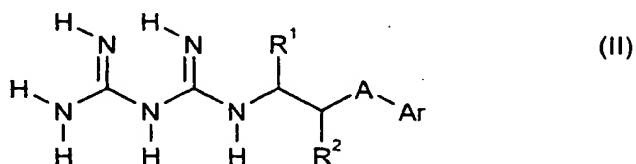
10

This gives 3.6 g (87% of theory) of 1-(1-ethyl-3-phenyl-propyl)-biguanide hydrochloride (racemate).

15

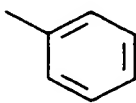
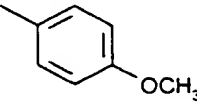
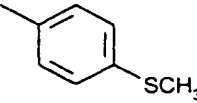
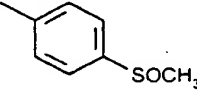
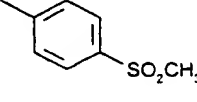
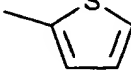
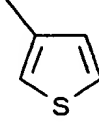
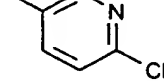
The reaction can be carried out at the same temperature even without solvent - i.e. in the melt.

By the method of Example (II-1), it is also possible to prepare, for example, the compounds of the formula (II) and their hydrochlorides listed in Table 2 below.

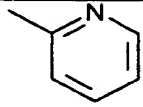
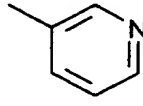
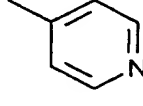
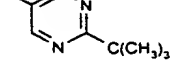


20

**Table 2:** Examples of compounds of the formula (II) - (hydrochlorides)

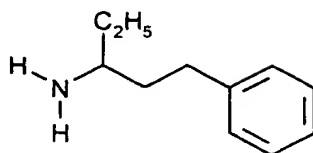
Ex. No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	A	Ar	Physical data and stereochemical specifications
(II-2)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		(racemate)
(II-3)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(racemate)
(II-4)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(racemate)
(II-5)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(racemate)
(II-6)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(racemate)
(II-7)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(racemate)
(II-8)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(racemate)
(II-9)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(racemate)

**Table 2** (continued)

Ex. No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	A	Ar	Physical data and stereochemical specifications
(II-10)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(racemate)
(II-11)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(racemate)
(II-12)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(racemate)
(II-13)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		(amorphous) (hydrochloride) (racemate)

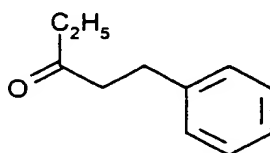
Starting materials of the formula (V):

Example (V-1)



5

Step 1

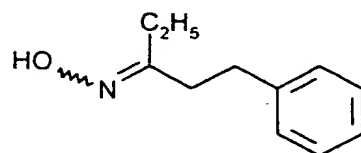


10 A mixture of 19.3 g (0.134 mol) of ethyl propionyl acetate, 7.5 g (0.11 mol) of sodium methoxide, 60 ml of ethanol and 50 ml of 10% strength aqueous sodium hydroxide solution is initially charged at room temperature (approximately 20°C) and the reaction mixture is, after dropwise addition of 12.6 g (0.10 mol) of benzyl chloride, stirred at approximately 60°C for about 5 hours. The mixture is subsequently concentrated under water pump vacuum and the residue is stirred with

15 The pH is then adjusted to 4 using 10% strength aqueous hydrochloric acid, and the mixture is shaken with diethyl ether. The organic phase is dried with sodium sulphate and filtered. The filtrate is concentrated under water pump vacuum and the residue is purified by column chromatography (silica gel/ethyl acetate).

20 This gives 13.9 g (85% of theory) of 1-phenyl-pentan-3-one.

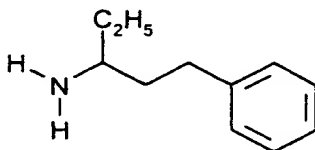
Step 2



25 A mixture of 13.9 g (86 mmol) of 1-phenyl-pentan-3-one, 8.9 g (128 mmol) of hydroxylamine hydrochloride and 10.1 g (128 mmol) of pyridine is stirred at

approximately 75°C for 2 hours. After cooling, the mixture is shaken with water/ethyl acetate and the organic phase is separated off, dried with sodium sulphate and filtered. The solvent is carefully distilled off from the filtrate under water pump vacuum. The residue, which essentially contains the compound 1-phenyl-pentan-3-one oxime of the above formula, is employed for the next step without any further purification.

Step 3



With stirring, 6.5 g (0.17 mol) of lithium aluminium hydride in 130 ml of tetrahydrofuran are added to a mixture of the product obtained in accordance with the description of step 2 and 130 ml of tetrahydrofuran, and the reaction mixture is stirred at approximately 60°C for 30 minutes. After cooling, the mixture is admixed with a solution of 1 g of sodium hydroxide in 30 ml of water, and the mixture is stirred at approximately 60°C for 30 minutes. After cooling, the mixture is filtered and the filtrate is concentrated under water pump vacuum. The residue is purified by column chromatography (silica gel, ethyl acetate).

This gives 6.3 g (45% of theory) of (R/S)-1-ethyl-3-phenyl-propylamine (racemate).



Use Examples:

Example A

5

Pre-emergence-test

Solvent: 5 parts by weight of acetone

Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

10

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amount of solvent, the stated amount of emulsifier is added and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

15

Seeds of the test plants are sown in normal soil. After about 24 hours, the soil is watered with the preparation of active compound. The amount of water per unit area is advantageously kept constant. The concentration of active compound in the preparation is immaterial, only the application rate of active compound per unit area matters.

20

After three weeks, the degree of damage to the plants is scored visually in % damage in comparison to the development of the untreated control.

25

The figures denote:

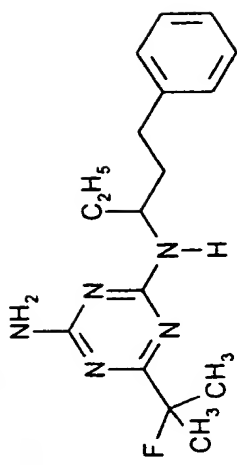
0 %	=	no effect (like untreated control)
100 %	=	total destruction

30

In this test, the compounds of Preparation Examples 1, 2, 12, 19, 21, 22, 29, 33, 41 and 45, for example, show strong activity against weeds, and some of them are tolerated well by crop plants, such as, for example, maize, wheat and cotton (cf. Table A).

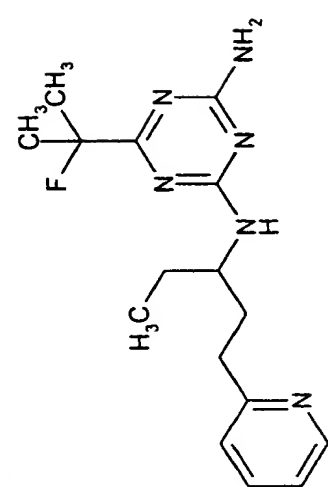
In the tables below, „ai” means „active ingredient”.

Table A: Pre-emergence test/greenhouse

Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Maize	Cotton	Alope- curus	Digi- taria	Abu- tilon	Galium	Matri- caria
 <chem>Nc1nc(C(F)(C)C)n(CCN(Cc2ccccc2)c1)c1ccccc1</chem>	500	0	0	100	100	100	100	100

(1)

Table A (continued)

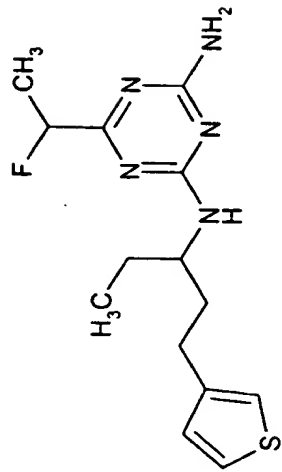
Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Wheat	Cotton	Cheno- podium	Solanum	Veronica	Viola
	500	0	0	100	100	100	100

(22)

**Table A** (continued)

Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Wheat	Digi- taria	Echi- nochloa	Abu- tilon	Amaran- thus	Da- tura	Poly- gonum	Vero- nica
<div data-bbox="730 1470 1136 1869" data-label="Chemical-Block"> <chem>CC(Cc1ccc(s1)CCNC2=NC(=NC(=C2)N)C(F)(F)F)CC</chem> </div> <div data-bbox="1234 1638 1274 1701" data-label="Text"> <p>(12)</p> </div>	500	0	80	100	100	100	100	100	100

**Table A** (continued)

Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Wheat	Digi- taria	Echi- nochloa	Abu- tilon	Amaran- thus	Da- tura	Poly- gonum	Vero- nica
	500	0	100	100	100	100	100	100	100

(19)

**Table A** (continued)

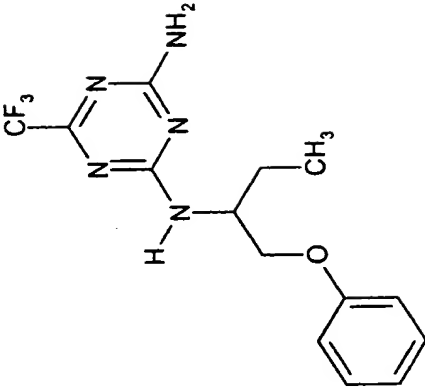
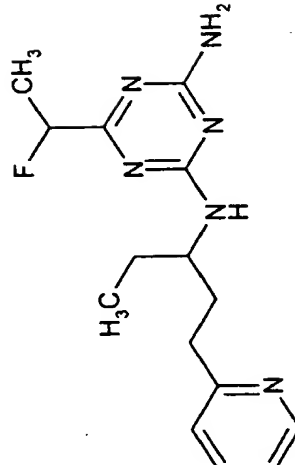
Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Maize	Abuti- lon	Amaran- thus	Sinapis
	1000	20	80	100	100
(2)					

Table A (continued)

Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Alopecurus	Setaria	Abutilon	Amaranthus	Galium
 <p>(21)</p>	1000	100	90	90	95	80





**Table A** (continued)

Active compound of  
Preparation Ex. No.

Application rate  
(g of ai./ha)

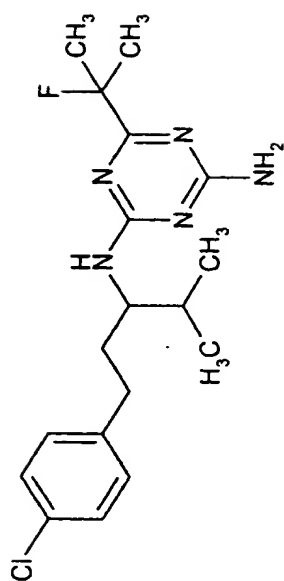
Alopecurus

Setaria

Abutilon

Amaranthus

Galium



1000

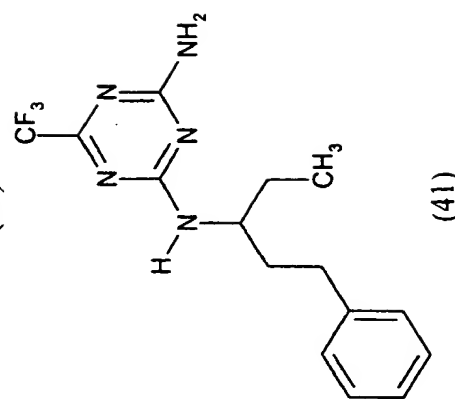
70

-

80

80

80



1000

90

100

100

100

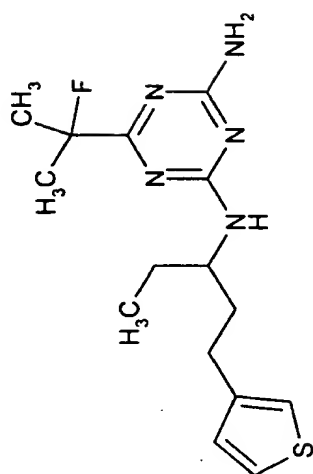
95

**Table A** (continued)

Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Alopecurus	Setaria	Abutilon	Amaranthus	Galium
<div data-bbox="743 1360 1172 1747" data-label="Chemical-Block"> <chem>CC(CCN1C=NC(=C1)C(F)(F)F)CCC2=CC=CC=C2</chem> </div> <div data-bbox="1269 1528 1302 1579" data-label="Text"> <p>(45)</p> </div>	1000	80	95	100	100	100

Table A (continued)

Active compound of	Application rate	Alo-	Setaria	Abu-	Ama-	Sinapis	Xan-
Preparation Ex. No.	(g of ai./ha)	pecurus		tilon	ranthus		thium



(33)

1000	100	100	90	100	100	90
------	-----	-----	----	-----	-----	----

**Example B**

Post-emergence-test

5                      Solvent:        5 parts by weight of acetone  
                         Emulsifier:    1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

10                    To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amount of solvent, the stated amount of emulsifier is added and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

15                    Test plants which have a height of 5-15 cm are sprayed with the preparation of active compound such that the particular amounts of active compounds desired are applied per unit area. The concentration of the spray liquor is chosen so that the particular amounts of active compound desired are applied in 1000 l of water/ha.

20                    After three weeks, the degree of damage to the plants is scored visually in % damage in comparison to the untreated control.

The figures denote:

0 % = no effect (like untreated control)

100 % = total destruction

25                    In this test, the compounds of Preparation Examples 1, 2, 4, 11, 12, 19, 22, 23, 24, 33, 41, 43, 44, 45 and 46, for example, show strong activity against weeds, and some of them are tolerated well by crop plants, such as, for example, maize and wheat (cf. Table B).

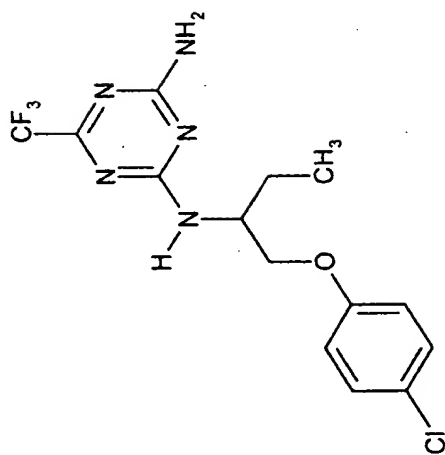
Table B: Post-emergence test/greenhouse

Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Wheat	Echino- chloa	Abutilon	Datura	Ipomoea	Veronica
<div data-bbox="646 1402 894 1850" data-label="Chemical-Block"> <chem>Nc1nc(C(F)(C)F)c(NC(C)Cc2ccccc2)n1</chem> </div>	250	0	80	100	100	100	100

(1)

Table B (continued)

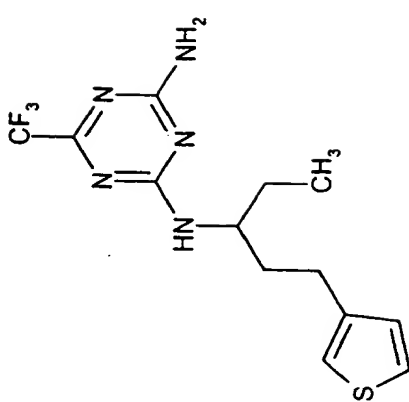
Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Maize	Setaria	Ama- ranthus	Xanthium
---	-----------------------------------	-------	---------	-----------------	----------



(46)

1000	0	100	100	70
------	---	-----	-----	----

Table B (continued)

Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Wheat	Echino- chloa	Setaria	Ama- ranthus	Ipo- moea	Poly- gonum	Sola- num
	500	10	90	95	100	100	100	100

(12)



Table B (continued)

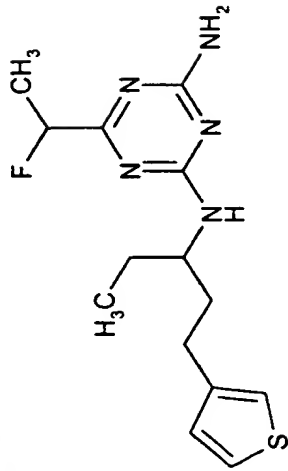
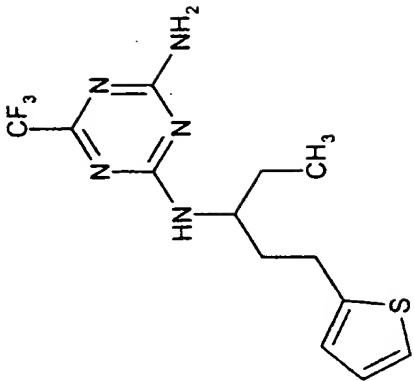
Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Wheat	Echino- chloa	Setaria	Ama- ranthus	Ipo- moea	Poly- gonum	Sola- num
 (19)	500	-	100	100	100	100	100	100
 (11)	500	10	80	95	100	100	100	100

Table B (continued)

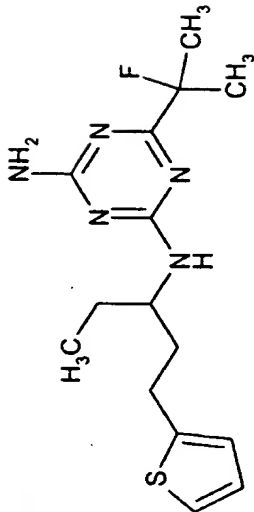
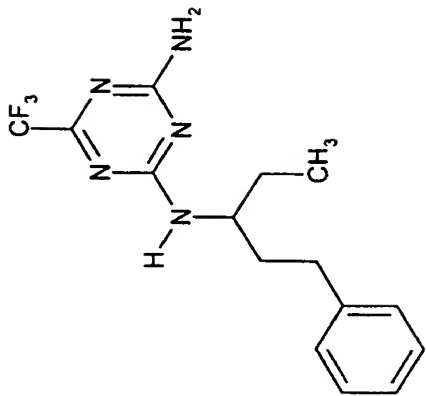
Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Wheat	Echino- chloa	Setaria	Ama- ranthus	Ipo- moea	Poly- gonum	Sola- num
 (24)	500	-	100	80	100	100	95	95
 (43)	500	10	-	90	100	100	100	100

Table B (continued)

Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Alope- curus	Seta- ria	Abu- tilon	Ama- ranthus	Galium	Xan- thium
<div data-bbox="519 1344 828 1816" data-label="Chemical-Block"> <chem>CC1=CC=CC=C1CCC(N)CC2=NC=NC(N)=C2C3C(F)C(C)C3</chem> </div>	1000	-	80	70	95	80	70

(22)

Table B (continued)

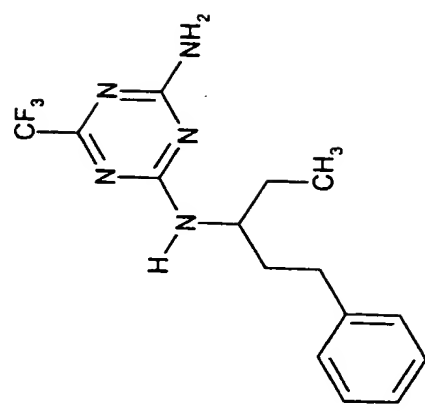
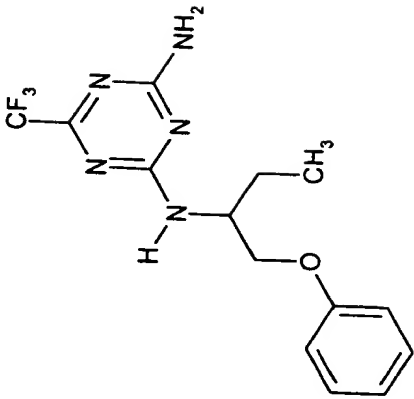
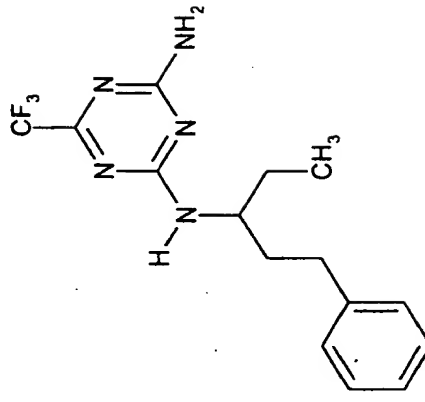
Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Alopecurus	Setaria	Abutilon	Amaranthus	Galium	Xanthium
 <p>(41)</p>	1000	80	100	100	100	100	100

Table B (continued)

Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Alope- curus	Seta- ria	Abu- tilon	Ama- ranthus	Galium	Xan- thium
	1000	70	100	100	100	100	100

(2)

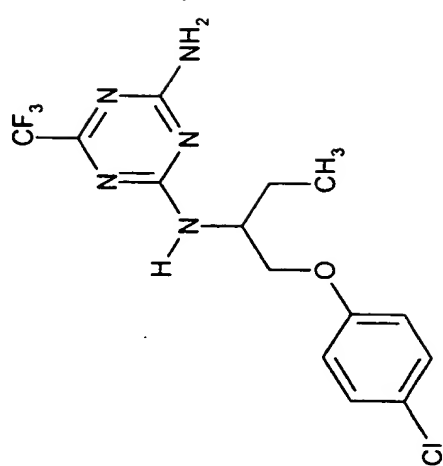
Table B (continued)

Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Alope- curus	Seta- ria	Abu- tilon	Ama- ranthus	Galium	Xan- thium
	1000	-	100	100	100	70	100

(43)

Table B (continued)

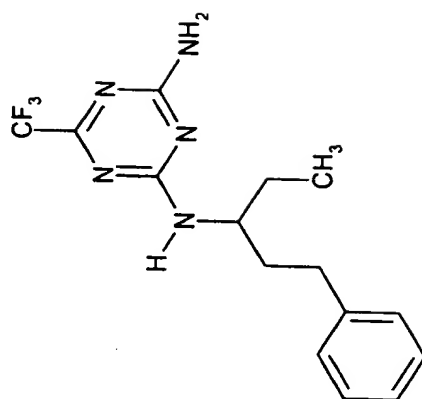
Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Alope- curus	Seta- ria	Abu- tilon	Ama- ranthus	Galium	Xan- thium
	1000	80	100	100	100	80	100



(44)

Table B (continued)

Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Alope- curus	Seta- ria	Abu- tilon	Ama- ranthus	Galium	Xan- thium
	1000	80	100	100	100	100	80

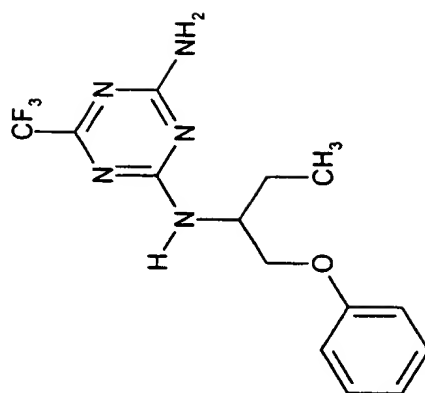


(45)



Table B (continued)

Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Alope- curus	Seta- ria	Abu- tilon	Ama- ranthus	Galium	Xan- thium
	1000	70	100	100	100	80	100



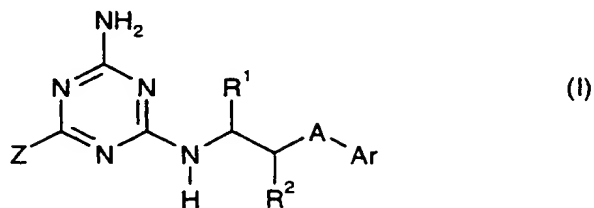
(4)

Table B (continued)

Active compound of Preparation Ex. No.	Application rate (g of ai./ha)	Alope- curus	Avena fatua	Cy- perus	Se- taria	Abu- tilon	Ama- ranthus	Sina- pis	Xan- thium
<div data-bbox="581 1394 834 1877" data-label="Chemical-Block"> </div> <div data-bbox="907 1614 948 1667" data-label="Text"> <p>(23)</p> </div>	1000	90	100	100	100	100	100	100	100
<div data-bbox="1021 1415 1321 1877" data-label="Chemical-Block"> </div> <div data-bbox="1403 1625 1443 1688" data-label="Text"> <p>(33)</p> </div>	1000	80	100	90	100	100	100	100	-

**Patent Claims**

1. Substituted 2-amino-4-alkylamino-1,3,5-triazines of the general formula (I),



in which

- $R^1$  represents in each case optionally substituted alkyl having 2 to 6 carbon atoms or cycloalkyl having 3 to 6 carbon atoms,
- $R^2$  represents hydrogen or represents alkyl having 1 to 4 carbon atoms,
- A represents oxygen or methylene,
- Ar represents in each case optionally substituted phenyl, naphthyl or heterocyclyl, and
- Z represents hydrogen, represents halogen or represents in each case optionally substituted alkyl, alkoxy, alkylcarbonyl, alkoxycarbonyl, alkylthio, alkylsulphinyl, alkylsulphonyl, alkenyl or alkynyl.
2. Compounds of the formula (I) according to Claim 1, characterized in that
- $R^1$  represents optionally hydroxyl-, cyano-, halogen- or  $C_1$ - $C_4$ -alkoxy-substituted alkyl having 2 to 4 carbon atoms or represents optionally

cyano-, halogen- or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-substituted cycloalkyl having 3 to 6 carbon atoms,

R<sup>2</sup> represents hydrogen, methyl or ethyl,

A represents oxygen or methylene,

Ar represents in each case optionally substituted phenyl, naphthyl or heterocyclyl,

where the possible heterocyclyl groupings are selected from the group below:

furyl, benzofuryl, dihydrobenzofuryl, tetrahydrofuryl, thienyl, benzo-thienyl, thiazolyl, benzothiazolyl, oxazolyl, benzoxazolyl, thiadiazolyl, oxadiazolyl, pyrazolyl, pyrrolyl, quinolinyl, isoquinolinyl, pyridinyl and pyrimidinyl,

and where the possible substituents are in each case selected from the group below:

hydroxyl, cyano, nitro, halogen, in each case optionally hydroxy-, cyano- or halogen-substituted alkyl or alkoxy having in each case 1 to 6 carbon atoms, in each case optionally halogen-substituted alkylcarbonyl, alkoxycarbonyl, alkylthio, alkylsulphinyl or alkylsulphonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms in the alkyl groups, in each case optionally hydroxyl-, cyano-, nitro-, halogen-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-halogenoalkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy- or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-halogenoalkoxy-substituted phenyl or phenoxy, and also in each case optionally halogen-substituted methylenedioxy or ethylenedioxy,

and

Z represents hydrogen, represents halogen, represents in each case optionally hydroxyl-, cyano-, nitro-, halogen-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylcarbonyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxycarbonyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylthio-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylsulphinyl- or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylsulphonyl-substituted alkyl, alkoxy, alkylcarbonyl, alkoxycarbonyl, alkylthio, alkylsulphinyl or alkylsulphonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms in the alkyl groups, or represents in each case optionally halogen-substituted alkenyl or alkynyl having in each case 2 to 6 carbon atoms.

3. Compounds of the formula (I) according to Claim 1, characterized in that

R<sup>1</sup> represents in each case optionally hydroxyl-, cyano-, fluorine-, chlorine-, methoxy- or ethoxy-substituted ethyl, n- or i-propyl, n-, i-, s- or t-butyl or represents in each case optionally cyano-, fluorine-, chlorine-, methyl- or ethyl-substituted cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl or cyclohexyl,

R<sup>2</sup> represents hydrogen or methyl,

A represents oxygen or methylene,

Ar represents in each case optionally substituted phenyl, naphthyl or heterocyclyl,

where the possible heterocyclyl groups are selected from the group below:

furyl, benzofuryl, dihydrobenzofuryl, tetrahydrofuryl, thienyl, benzo-thienyl, thiazolyl, benzothiazolyl, oxazolyl, benzoxazolyl, thiadiazolyl, oxadiazolyl, pyrazolyl, pyrrolyl, quinolinyl, isoquinolinyl, pyridinyl and pyrimidinyl,

and where the possible substituents are in each case selected from the group below:

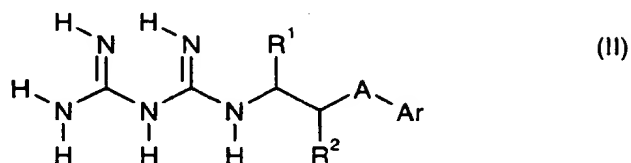
hydroxy, cyano, nitro, fluorine, chlorine, bromine, in each case optionally hydroxyl-, cyano-, fluorine- or chlorine-substituted methyl, ethyl, n- or i-propyl, n-, i-, s- or t-butyl, methoxy, ethoxy, n- or i-propoxy, n-, i-, s- or t-butoxy, in each case optionally fluorine- or chlorine-substituted acetyl, propionyl, n- or i-butyryl, methoxycarbonyl, ethoxycarbonyl, n- or i-propoxycarbonyl, methylthio, ethylthio, n- or i-propylthio, methylsulphinyl, ethylsulphinyl, n- or i-propylsulphinyl, methylsulphonyl, ethylsulphonyl, n- or i-propylsulphonyl, in each case optionally hydroxyl-, cyano-, nitro-, fluorine-, chlorine-, bromine-, methyl-, ethyl-, n- or i-propyl-, n-, i-, s- or t-butyl-, trifluoromethyl-, methoxy-, ethoxy-, n- or i-propoxy-, n-, i-, s- or t-butoxy-, difluoromethoxy- or trifluoromethoxy-substituted phenyl or phenoxy, and also in each case optionally fluorine- or chlorine-substituted methylenedioxy or ethylenedioxy,

and

Z represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, represents in each case optionally hydroxyl-, cyano-, nitro-, fluorine-, chlorine-, methoxy-, ethoxy-, n- or i-propoxy-, n-, i-, s- or t-butoxy-, methylthio-, ethylthio-, n- or i-propylthio-, methylsulphinyl-, ethylsulphinyl-, n- or i-propylsulphinyl-, methylsulphonyl-, ethylsulphonyl-, n- or i-propylsulphonyl-substituted methyl, ethyl, n- or i-propyl, n-, i-, s- or t-butyl, methoxy, ethoxy, n- or i-propoxy, n-, i-, s- or t-butoxy, methylthio, ethylthio, n- or i-propylthio, methylsulphinyl, ethylsulphinyl, n- or i-propylsulphinyl, methylsulphonyl, ethylsulphonyl, n- or i-propylsulphonyl, or represents in each case optionally fluorine-, chlorine- or bromine-substituted ethenyl, propenyl, butenyl, ethinyl, propinyl or butinyl.

4. Process for preparing compounds of the formula (I) according to Claim 1, characterized in that

(a) substituted biguanides of the general formula (II),



in which

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A and Ar are each as defined in Claim 1

- and/or acid adducts of compounds of the general formula (II) -

are reacted with alkoxycarbonyl compounds of the general formula (III)



in which

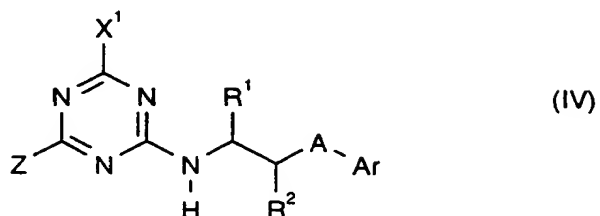
Z is as defined in Claim 1 and

R' represents alkyl,

if appropriate in the presence of a reaction auxiliary and if appropriate in the presence of a diluent,

or that

(b) substituted triazines of the general formula (IV)



in which

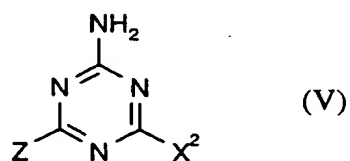
R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A, Ar and Z are each as defined above and

X<sup>1</sup> represents halogen or alkoxy

are reacted with ammonia, if appropriate in the presence of a reaction auxiliary and if appropriate in the presence of a diluent,

or that

(c) substituted triazines of the general formula (V),



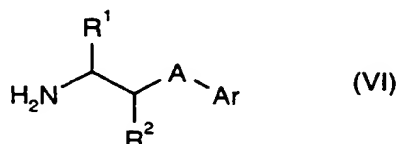
in which

Z is as defined above and



X<sup>2</sup> represents halogen or alkoxy

are reacted with substituted alkylamines of the general formula (VI),



in which

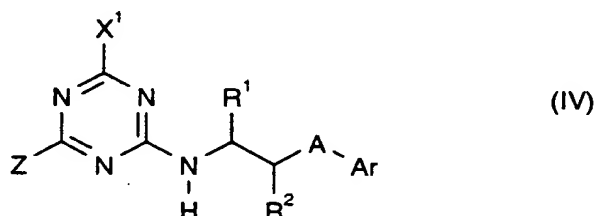
R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A and Ar are each as defined above,

if appropriate in the presence of a reaction auxiliary and if appropriate in the presence of a diluent,

and, if appropriate, further conversions within the scope of the above definition of substituents are carried out by customary methods on the compounds of the general formula (I) obtained by the processes described under (a), (b) or (c).

5. Herbicidal compositions, characterized in that they comprise at least one compound of the formula (I) according to Claim 1.
6. The use of compounds of the formula (I) according to Claim 1 for controlling undesirable vegetation.
7. Method for controlling weeds, characterized in that compounds of the formula (I) according to Claim 1 are allowed to act on weeds or their habitat.

8. Process for preparing herbicidal compositions, characterized in that compounds of the formula (I) according to Claim 1 are mixed with extenders and/or surfactants.
9. Substituted triazines of the general formula (IV)

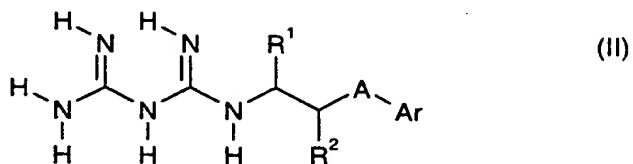


in which

R¹, R², A, Ar and Z are each as defined in Claim 1 and

X¹ represents halogen or alkoxy.

10. Substituted biguanides of the general formula (II)



in which

R¹, R², A and Ar are each as defined in Claim 1,

and/or acid adducts of compounds of the general formula (II).

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die in der selben Patentfamilie gehören

I. des Aktenzeichens

PCT/EP 97/05318

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 273328 A	06-07-88	DE 3789294 D	14-04-94
		DE 3789294 T	16-06-94
		JP 1853764 C	07-07-94
		JP 63264465 A	01-11-88
		US 4844731 A	04-07-89
EP 411153 A	06-02-91	AT 142630 T	15-09-96
		AU 628138 B	10-09-92
		AU 5082790 A	05-09-90
		CA 2027562 A,C	21-08-90
		DE 69028461 D	17-10-96
		DE 69028461 T	06-02-97
		EP 0620220 A	19-10-94
		ES 2094150 T	16-01-97
		WO 9009378 A	23-08-90
		JP 7112981 A	02-05-95
		JP 7039400 B	01-05-95
		KR 9401728 B	05-03-94
		LV 10864 B	20-06-96
		RU 2058983 C	27-04-96
		US 5403815 A	04-04-95
EP 509544 A	21-10-92	US 5290754 A	01-03-94
		LT 640 A,B	27-12-94
EP 509544 A	21-10-92	JP 2653600 B	17-09-97
		JP 5320145 A	03-12-93
		US 5250686 A	05-10-93
WO 9708156 A	06-03-97	DE 19531084 A	27-02-97
		AU 6741896 A	19-03-97

PCT

ORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales Büro

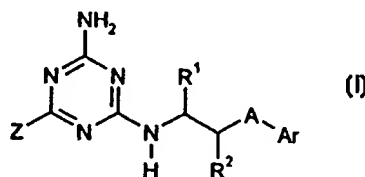


INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation <sup>6</sup> : <b>C07D 251/18, A01N 43/68, C07D 401/12, 409/12</b>		(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: <b>WO 98/15537</b>
A1		(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 16. April 1998 (16.04.98)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP97/05318 (22) Internationales Anmeldedatum: 29. September 1997 (29.09.97) (30) Prioritätsdaten: 196 41 691.4 10. Oktober 1996 (10.10.96) DE (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE). (72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): RIEBEL, Hans-Jochem [DE/DE]; In der Beck 92, D-42113 Wuppertal (DE). LEHR, Stefan [DE/DE]; Am Benthall 54, D-51381 Leverkusen (DE). STELZER, Uwe [DE/DE]; Adolf-Kolping-Strasse 22a, D-51399 Burscheid (DE). WATANABE, Yukiyoishi [JP/JP]; 2-8-24, Hanagaki-cho, Oyama-shi, Tochigi 323 (JP). DOLLINGER, Markus [DE/DE]; Burscheider Strasse 154b, D-51381 Leverkusen (DE). (74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).		(81) Bestimmungsstaaten: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, IT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ARIPO Patent (GH, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).  Veröffentlicht Mit internationalem Recherchenbericht. Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.

(54) Title: SUBSTITUTED 2-AMINO-4-ALKYLAMINO-1,3,5-TRIAZINES AS HERBICIDES

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE 2-AMINO-4-ALKYLAMINO-1,3,5-TRIAZINE ALS HERBIZIDE



(57) Abstract

The invention relates to novel substituted 2-amino-4-alkylamino-1,3,5-triazines of formula (I), in which R<sup>1</sup> stands for respectively optionally substituted alkyl with 2 to 6 carbon atoms or cycloalkyl with 3 to 6 carbon atoms, R<sup>2</sup> stands for hydrogen or alkyl with 1 to 4 carbon atoms, A for oxygen or methylene, Ar for respectively optionally substituted phenyl, naphthyl or heterocycyl, and Z for hydrogen, for halogen or for respectively optionally substituted alkyl, alkoxy, alkylcarbonyl, alkoxycarbonyl, alkylthio, alkylsulfanyl, alkylsulfonyl, alkenyl or alkynyl, methods and new intermediate products for their production and their use as herbicides.

(57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft neue substituierte 2-Amino-4-alkylamino-1,3,5-triazine der Formel (I), in welcher R<sup>1</sup> für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, R<sup>2</sup> für Wasserstoff oder für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, A für Sauerstoff oder Methylen steht, Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocycyl steht, und Z für Wasserstoff, für Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfanyl, Alkylsulfonyl, Alkenyl oder Alkynyl steht, Verfahren und neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

# LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

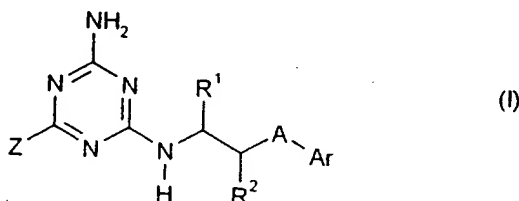
AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidshan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland			TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	ML	Mali	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MN	Mongolei	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MR	Mauretanien	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MW	Malawi	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	MX	Mexiko	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NE	Niger	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NL	Niederlande	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NO	Norwegen	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	NZ	Neuseeland		
CM	Kamerun			PL	Polen		
CN	China	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CU	Kuba	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CZ	Tschechische Republik	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
DE	Deutschland	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DK	Dänemark	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
EE	Estland	LR	Liberia	SG	Singapur		

## SUBSTITUIERTE 2-AMINO-4-ALKYLAMINO-1,3,5-TRIAZINE ALS HERBIZIDE

Die Erfindung betrifft neue substituierte 2-Amino-4-alkylamino-1,3,5-triazine, Verfahren und neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung als Herbizide.

Eine Reihe von substituierten 2,4-Diamino-triazinen ist bereits aus der (Patent-)Literatur bekannt (vgl. US 3816419, US 3932167, EP 191496, EP 273328, EP 411153 / WO 90/09378, WO 97/00254, WO 97/08156). Diese Verbindungen haben jedoch bisher keine besondere Bedeutung erlangt.

Es wurden nun die neuen substituierten 2-Amino-4-alkylamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I) gefunden,

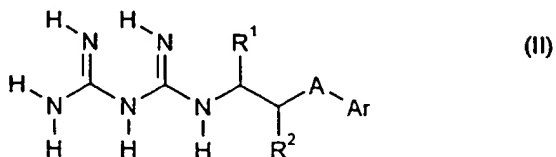


in welcher

- R<sup>1</sup> für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- R<sup>2</sup> für Wasserstoff oder für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,
- A für Sauerstoff oder Methylen steht,
- Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl steht, und
- Z für Wasserstoff, für Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkenyl oder Alkynyl steht.

Man erhält die neuen substituierten 2-Amino-4-alkylamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I), wenn man

(a) substituierte Biguanide der allgemeinen Formel (II)



5 in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , A und Ar die oben angegebene Bedeutung haben,

- und/oder Säureaddukte von Verbindungen der allgemeinen Formel (II) -

mit Alkoxycarbonylverbindungen der allgemeinen Formel (III)



10 in welcher

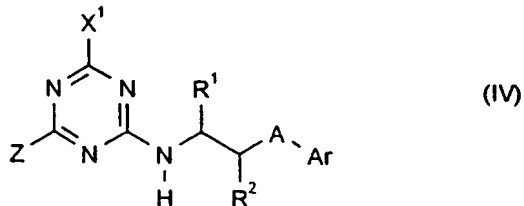
Z die oben angegebene Bedeutung hat und

$R'$  für Alkyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

15 oder wenn man

(b) substituierte Triazine der allgemeinen Formel (IV)



in welcher

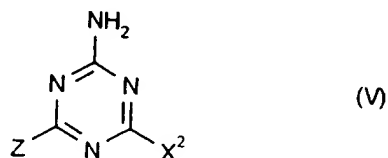
$R^1$ ,  $R^2$ , A, Ar und Z die oben angegebene Bedeutung haben und

$X^1$  für Halogen oder Alkoxy steht,

mit Ammoniak gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder wenn man

5 (c) substituierte Triazine der allgemeinen Formel (V)

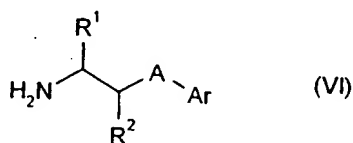


in welcher

Z die oben angegebene Bedeutung hat und

$X^2$  für Halogen oder Alkoxy steht,

10 mit substituierten Alkylaminen der allgemeinen Formel (VI)



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , A und Ar die oben angegebene Bedeutung haben,

15 gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

und gegebenenfalls an den gemäß den unter (a), (b) oder (c) beschriebenen Verfahren erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der obigen Substituentendefinition weitere Umwandlungen nach üblichen Methoden durchführt.

20 Die neuen substituierten 2-Amino-4-alkylamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke und selektive herbizide Wirksamkeit aus.



Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) enthalten mindestens ein asymmetrisch substituiertes Kohlenstoffatom und können deshalb in verschiedenen enantiomeren (R- und S- konfigurierten Formen) bzw. diastereomeren Formen vorliegen. Die Erfindung betrifft sowohl die verschiedenen möglichen  
5 einzelnen enantiomeren bzw. stereoisomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) wie auch die Gemische dieser isomeren Verbindungen.

In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl - auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy oder Alkylthio - jeweils geradkettig oder verzweigt.

Halogen steht im allgemeinen für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, vorzugsweise für  
10 Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

Gegenstand der Erfindung sind vorzugsweise Verbindungen der Formel (I), in welcher

R<sup>1</sup> für gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch  
15 Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht,

A für Sauerstoff oder Methylen steht,

Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl  
20 steht,

wobei die möglichen Heterocyclylgruppierungen vorzugsweise aus der folgenden Gruppe ausgewählt sind:

Furyl, Benzofuryl, Dihydrobenzofuryl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Thiadiazolyl, Oxadiazolyl,  
25 Pyrazolyl, Pyrrolyl, Chinoliny, Isochinoliny, Pyridiny und Pyrimidiny,

und wobei die möglichen Substituenten jeweils vorzugsweise aus folgender Gruppe ausgewählt sind:

Hydroxy, Cyano, Nitro, Halogen, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano oder Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6

5 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl-carbonyl, Alkoxy-carbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Phenoxy, sowie jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Methylendioxy oder Ethylendioxy,

und

10 Z für Wasserstoff, für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylcarbonyl, Alkoxy-carbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht.

Aus den vorausgehend als bevorzugt („vorzugsweise“) definierten Verbindungen der Formel (I) seien folgende Gruppen besonders herausgehoben:

20 (A) die Verbindungen der Formel (I), in welcher A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und Z die vorausgehend angegebene Bedeutung haben und Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Naphthyl steht, wobei die möglichen Substituenten die vorausgehend angegebene Bedeutung haben;

25 (B) die Verbindungen der Formel (I), in welcher A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und Z die vorausgehend angegebene Bedeutung haben und Ar für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht, wobei die möglichen Heterocyclylgruppierungen und die möglichen Substituenten die vorausgehend angegebene Bedeutung haben.

Die Erfindung betrifft insbesondere Verbindungen der Formel (I), in welcher

30 R<sup>1</sup> für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

R<sup>2</sup> für Wasserstoff oder Methyl steht,

- A für Sauerstoff oder Methylen steht,
- Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl steht,
- 5 wobei die möglichen Heterocyclylgruppierungen vorzugsweise aus der folgenden Gruppe ausgewählt sind:
- Furyl, Benzofuryl, Dihydrobenzofuryl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Thiadiazolyl, Oxadiazolyl, Pyrazolyl, Pyrrolyl, Chinoliny, Isochinoliny, Pyridiny und Pyrimidiny,
- 10 und wobei die möglichen Substituenten jeweils vorzugsweise aus folgender Gruppe ausgewählt sind:
- Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Phenoxy, sowie jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Methylen-dioxy oder Ethylendioxy,
- 15
- 20
- und
- 25 Z für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl,
- 30

oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Ethinyl, Propinyl oder Butinyl steht.

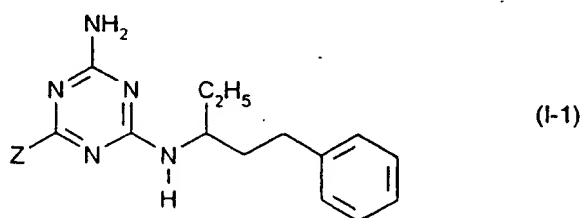
Aus den vorausgehend als insbesondere bevorzugt definierten Verbindungen der Formel (I) seien folgende Gruppen besonders herausgehoben:

- 5 (AA) die Verbindungen der Formel (I), in welcher A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und Z die vorausgehend angegebene Bedeutung haben und Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Naphthyl steht, wobei die möglichen Substituenten die vorausgehend angegebene Bedeutung haben, mit der Maßgabe, daß die Substituenten des Kohlenstoffatoms, an das R<sup>1</sup> gebunden ist, in R-Konfiguration angeordnet sind;
- 10 (BB) die Verbindungen der Formel (I), in welcher A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und Z die vorausgehend angegebene Bedeutung haben und Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Naphthyl steht, wobei die möglichen Substituenten die vorausgehend angegebene Bedeutung haben, mit der Maßgabe, daß die Substituenten des Kohlenstoffatoms, an das R<sup>1</sup> gebunden ist, in S-Konfiguration angeordnet sind;
- 15 (CC) die Verbindungen der Formel (I), in welcher A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und Z die vorausgehend angegebene Bedeutung haben und Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes Furyl, Thienyl, Pyridinyl oder Pyrimidinyl steht, wobei die möglichen Substituenten die vorausgehend angegebene Bedeutung haben, mit der Maßgabe, daß diese Verbindungen als racemische Gemische vorliegen;
- 20 (DD) die Verbindungen der Formel (I), in welcher A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und Z die vorausgehend angegebene Bedeutung haben und Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes Furyl, Thienyl, Pyridinyl oder Pyrimidinyl steht, wobei die möglichen Substituenten die vorausgehend angegebene Bedeutung haben, mit der Maßgabe, daß die Substituenten des Kohlenstoffatoms, an das R<sup>1</sup> gebunden ist, in R-Konfiguration angeordnet sind;
- 25 (EE) die Verbindungen der Formel (I), in welcher A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und Z die vorausgehend angegebene Bedeutung haben und Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes Furyl, Thienyl, Pyridinyl oder Pyrimidinyl steht, wobei die möglichen Substituenten die vorausgehend angegebene Bedeutung haben, mit der Maßgabe, daß die Substituenten des Kohlenstoffatoms, an das R<sup>1</sup> gebunden ist, in S-Konfiguration angeordnet sind.
- 30 Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese

Restdefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.

Beispiele für die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) sind in den nachstehenden Gruppen aufgeführt. Die allgemeinen Formeln stehen hierbei jeweils für die R-Enantiomeren, die S-Enantiomeren und die Racemate.

### Gruppe 1

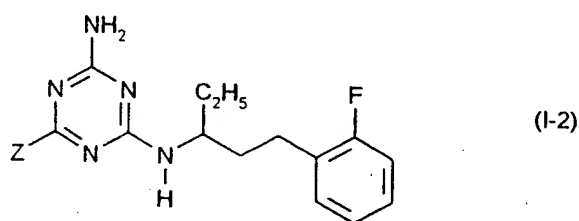


Z hat hierbei beispielhaft die nachfolgend angegebenen Bedeutungen:

- Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Fluormethyl, Di-  
 fluormethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, Dichlormethyl, Chlorfluormethyl, Chlor-  
 brommethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Bromdifluormethyl, Trichlor-  
 methyl, 1-Fluor-ethyl, 2-Fluor-ethyl, 1-Chlor-ethyl, 2-Chlor-ethyl, 1-Chlor-1-fluor-  
 ethyl, 1-Fluor-propyl, 2-Fluor-propyl, 3-Fluor-propyl, 1-Fluor-1-methyl-ethyl, 2-  
 Fluor-1-methyl-ethyl, 1-Chlor-1-methyl-ethyl, 1-Fluor-1-methyl-propyl, 1-Chlor-1-  
 ethyl-propyl, 1-Fluor-1-ethyl-propyl, 1-Chlor-1-ethyl-propyl, 1-Fluor-2-methyl-  
 propyl, 1-Chlor-2-methyl-propyl, 1-Chlor-propyl, 2-Chlor-propyl, 3-Chlor-propyl, 1-  
 Chlor-1-methyl-ethyl, 2-Chlor-1-methyl-ethyl, 1,1-Difluor-ethyl, 1,2-Difluor-ethyl,  
 1,1-Dichlor-ethyl, 2,2,2-Trifluor-ethyl, 1,2,2,2-Tetrafluor-ethyl, Perfluorethyl, 1,1-  
 Difluor-propyl, 1,1-Dichlor-propyl, Perfluorpropyl, 1-Fluor-butyl, 1-Chlor-butyl, Per-  
 fluorpentyl, Perfluorhexyl, 1-Hydroxy-ethyl, Acetyl, 1,1-Bis-acetyl-methyl, 1-Acetyl-  
 1-methoxycarbonyl-methyl, 1-Acetyl-1-ethoxycarbonyl-methyl, Methoxymethyl, 1,1-  
 Dimethoxy-methyl, 1-Methoxyethyl, 2-Methoxy-ethyl, 1,1-Dimethoxy-ethyl, Ethoxy-  
 methyl, 1-Ethoxyethyl, 2-Ethoxy-ethyl, 2-Methoxy-1-methyl-ethyl, 2-Methoxy-1-  
 ethyl-ethyl, 2-Ethoxy-1-methyl-ethyl, 2-Ethoxy-1-ethyl-ethyl, Methylthiomethyl,  
 Ethylthiomethyl, 1-Methylthio-ethyl, 2-Methylthioethyl, 1-Ethylthio-ethyl, 2-Ethyl-  
 thioethyl, Methylsulfinylmethyl, Ethylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Ethyl-  
 sulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i- Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder  
 i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Fluor-  
 methoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Fluorethoxy, Difluorethoxy, Trifluor-

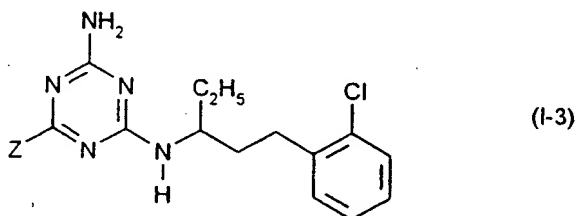
ethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Vinyl, 1-Chlor-vinyl, 2-Chlor-vinyl, 1-Fluor-vinyl, 2-Fluor-vinyl, 1-Brom-vinyl, 2-Brom-vinyl, 1,2-Dichlor-vinyl, 1,2-Dibrom-vinyl, 1,2-Difluor-vinyl, 2,2-Dichlor-vinyl, 2,2-Difluor-vinyl, 2,2-Dibrom-vinyl, 1-Chlor-2-fluor-vinyl, 2-Brom-2-chlor-vinyl, Trichlorvinyl, Allyl, 2-Chlor-allyl, 3-Chlor-allyl, 3,3-Dichlor-allyl, 1-Propenyl, Isopropenyl, 1-Chlor-2-propenyl, 1-Fluor-2-propenyl, 1-Brom-2-propenyl, 1,2-Dichlor-1-propenyl, 1,2-Dibrom-1-propenyl, 1,2-Difluor-1-propenyl, 1,1-Dichlor-2-propenyl, 1,1-Dibrom-2-propenyl, 1,1-Difluor-2-propenyl, 1,1,3,3,3-Pentafluor-2-propenyl, 2-Buten-1-yl, 2-Buten-2-yl, 3-Chlor-2-butenyl, 3-Brom-2-butenyl, 3,3,3-Trifluor-2-butenyl, Ethinyl, 2-Chlor-ethinyl, 2-Brom-ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 3,3,3-Trifluor-1-propinyl.

### Gruppe 2



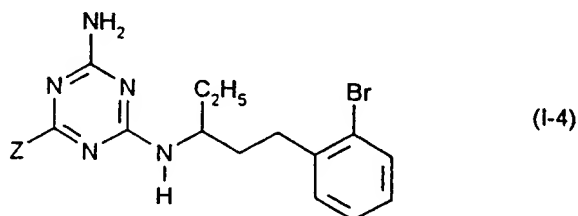
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

### Gruppe 3

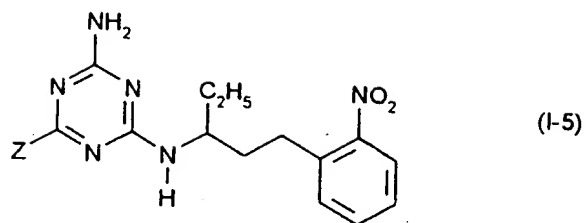


Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

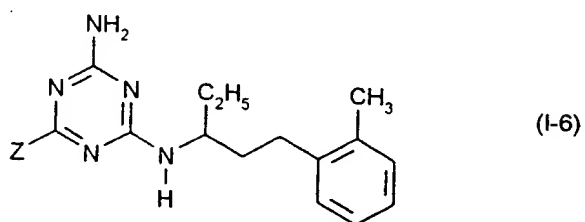
### Gruppe 4



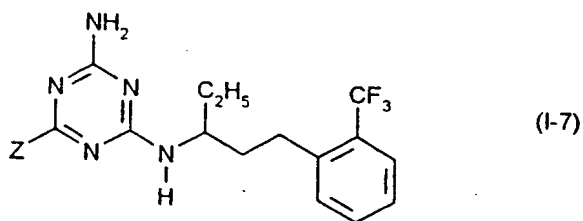
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 5

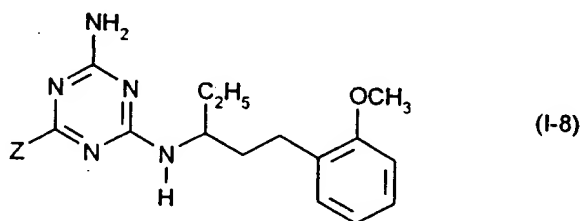
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5 Gruppe 6

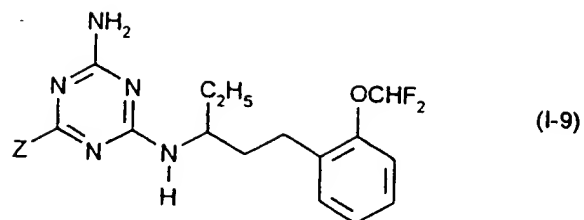
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 7

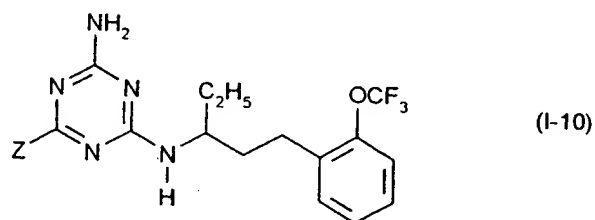
10 Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 8

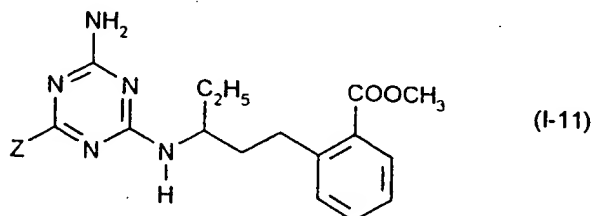
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 9

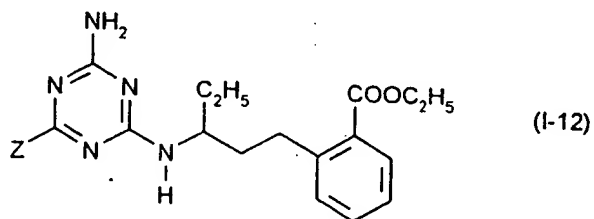
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5 Gruppe 10

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

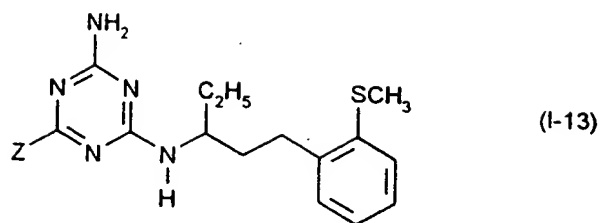
Gruppe 11

10 Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

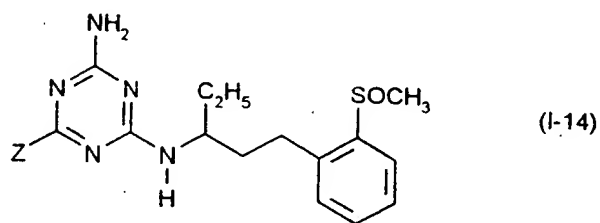
Gruppe 12

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.



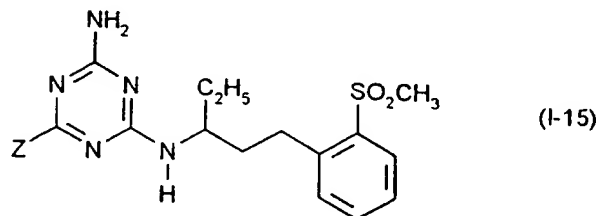
Gruppe 13

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 14

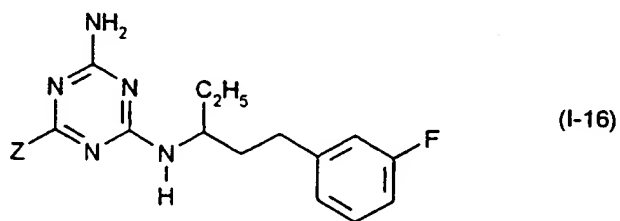
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

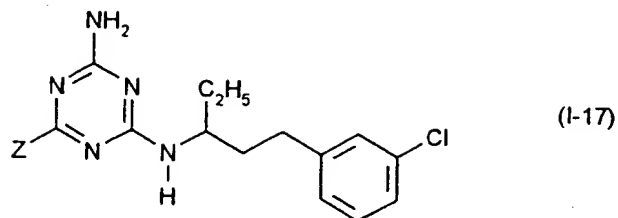
Gruppe 15

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

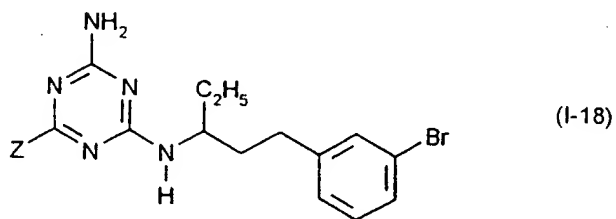
10

Gruppe 16

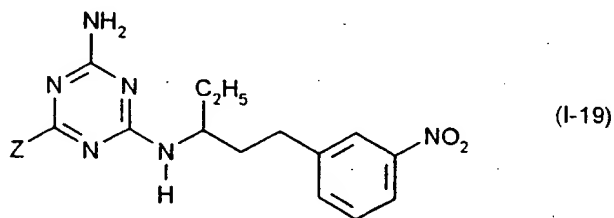
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 17

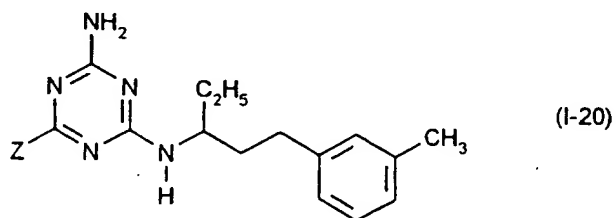
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5 Gruppe 18

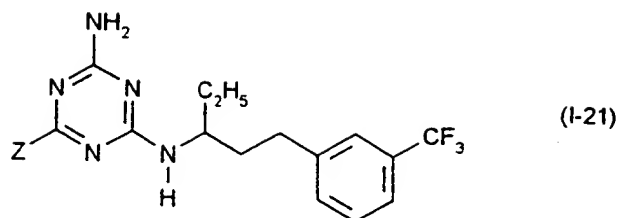
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 19

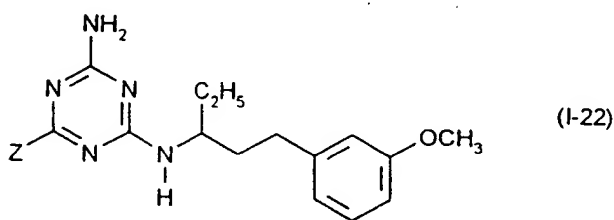
10 Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 20

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

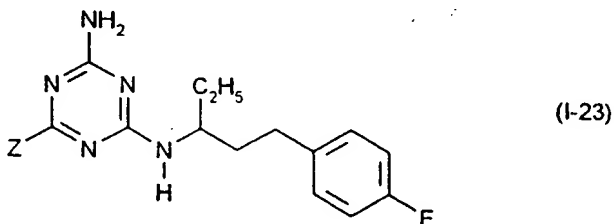
Gruppe 21

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 22

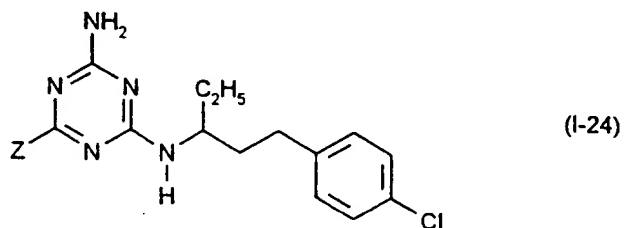
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

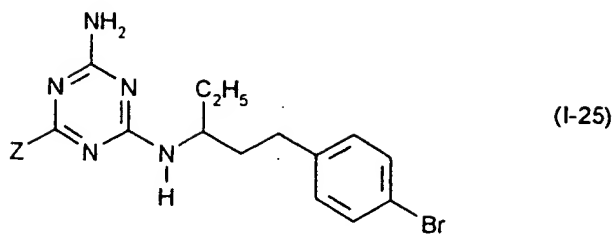
Gruppe 23

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

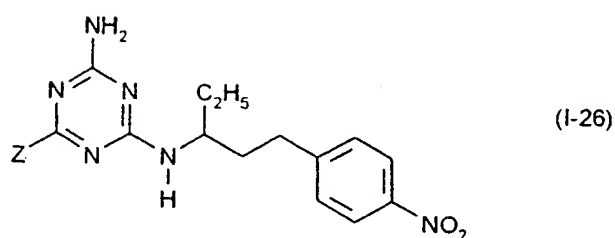
10

Gruppe 24

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

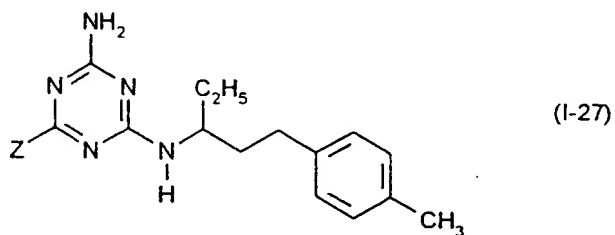
Gruppe 25

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 26

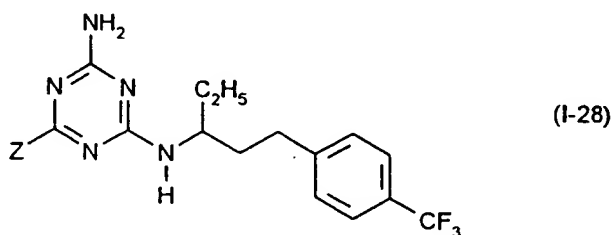
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

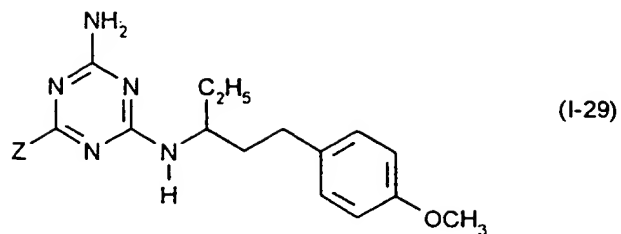
Gruppe 27

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

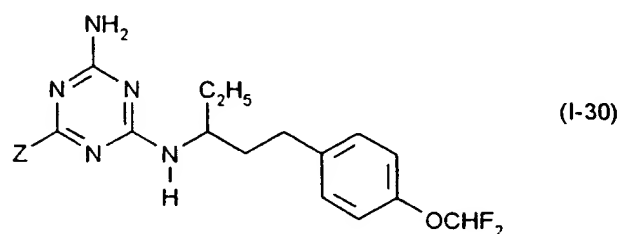
10

Gruppe 28

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

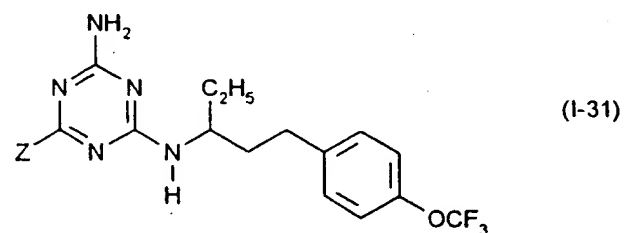
Gruppe 29

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 30

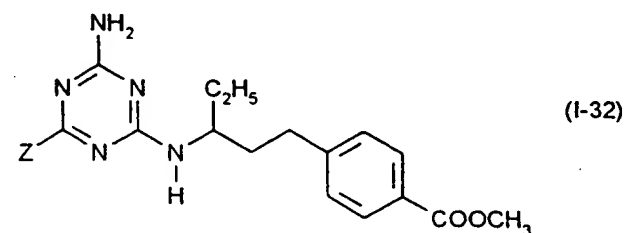
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

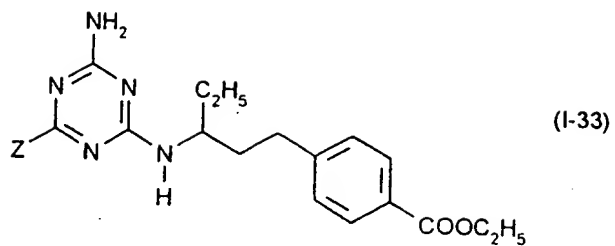
Gruppe 31

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

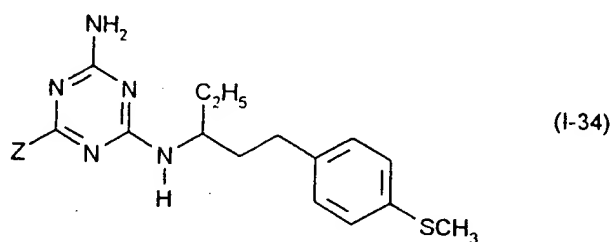
10

Gruppe 32

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

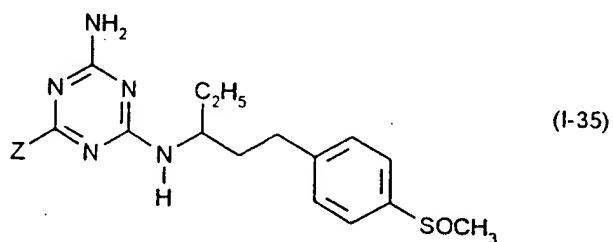
Gruppe 33

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 34

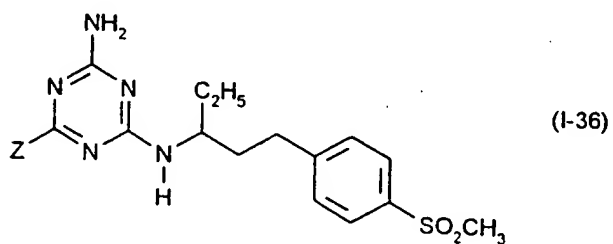
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 35

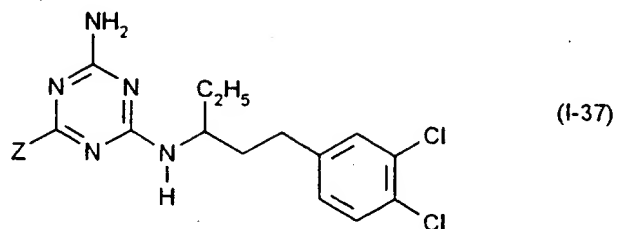
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 36

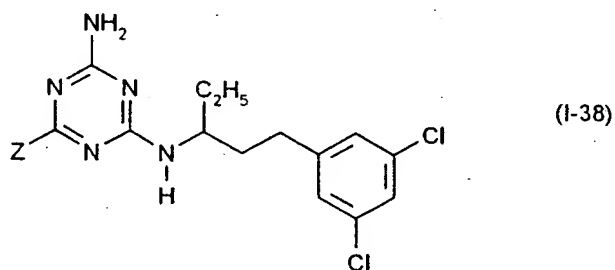
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 37



5 Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

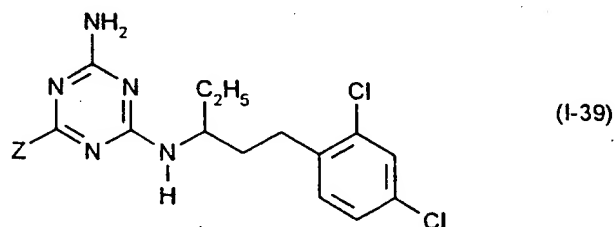
Gruppe 38



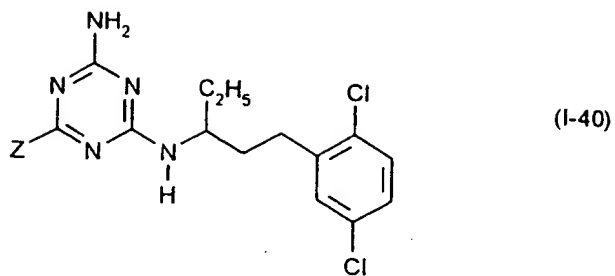
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

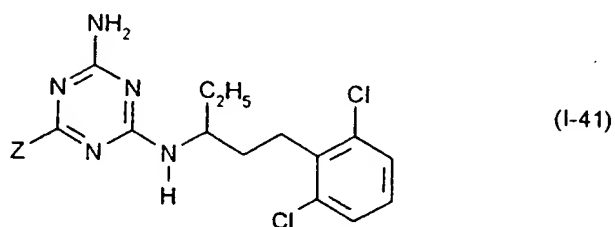
Gruppe 39



Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

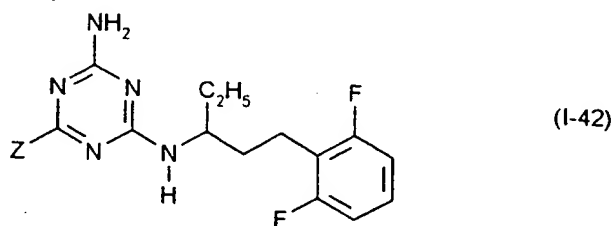
Gruppe 40

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 41

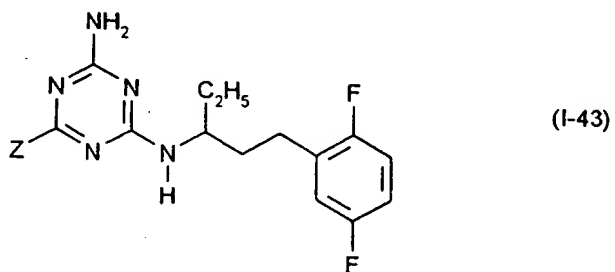
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 42

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

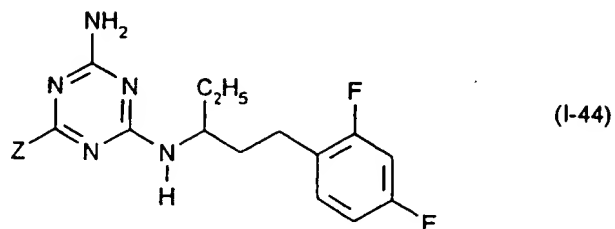
10

Gruppe 43



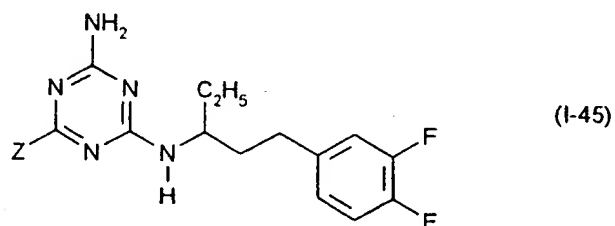
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 44



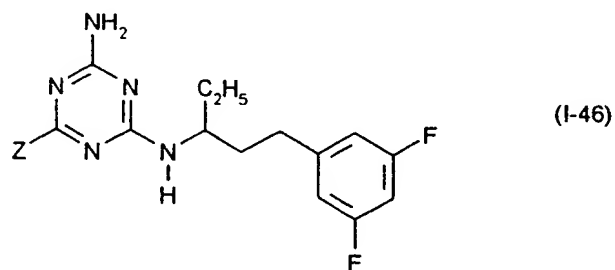
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5 Gruppe 45



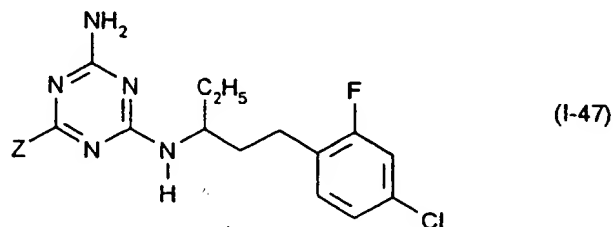
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 46



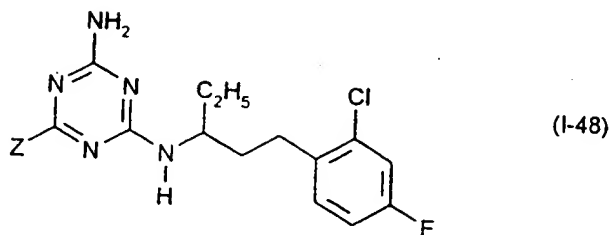
10 Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 47



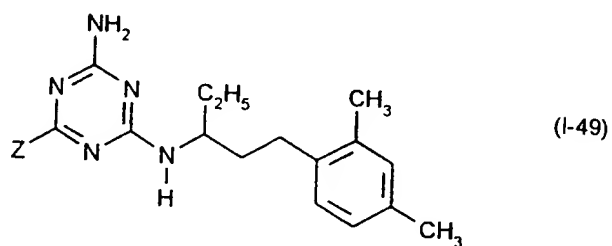
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 48



5 Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

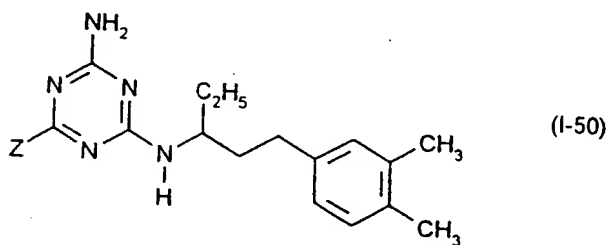
Gruppe 49



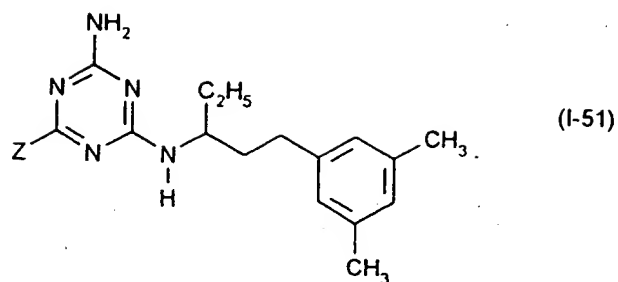
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10.

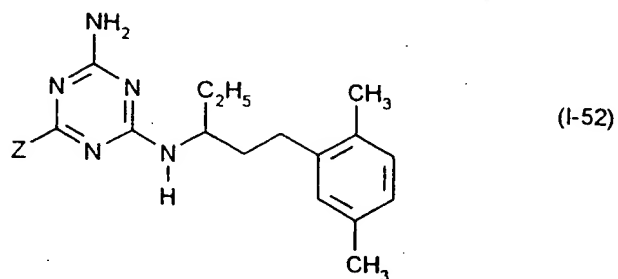
Gruppe 50



Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

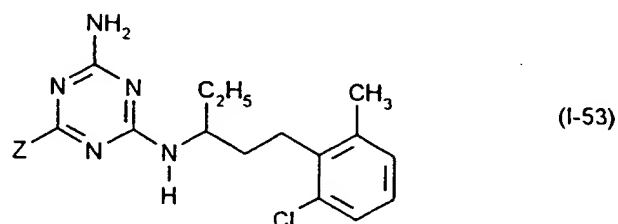
Gruppe 51

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 52

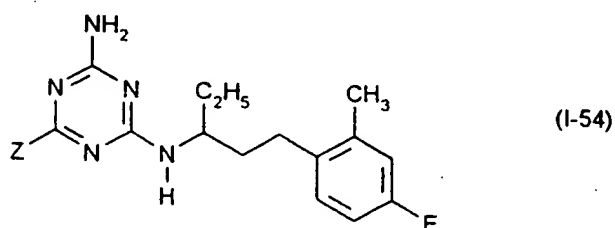
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 53

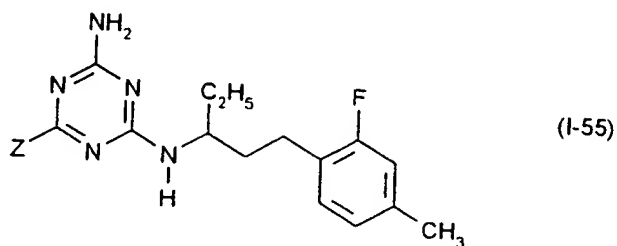
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 54

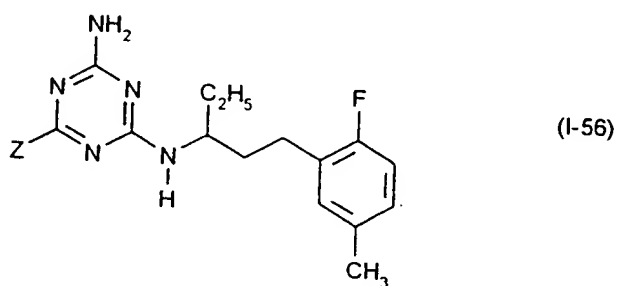
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 55



5 Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

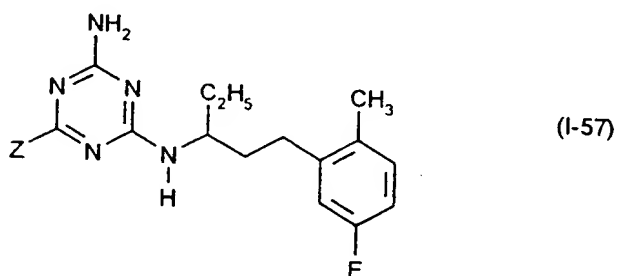
Gruppe 56



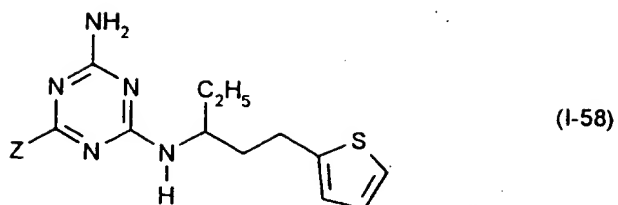
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

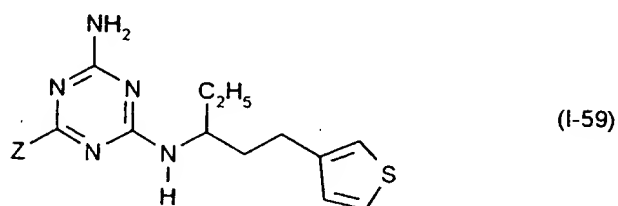
Gruppe 57



Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

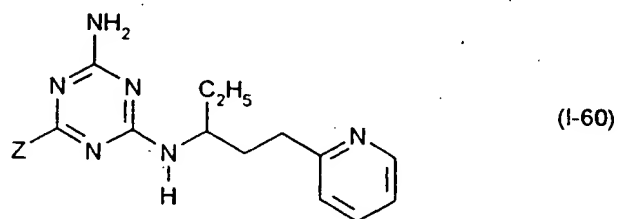
Gruppe 58

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 59

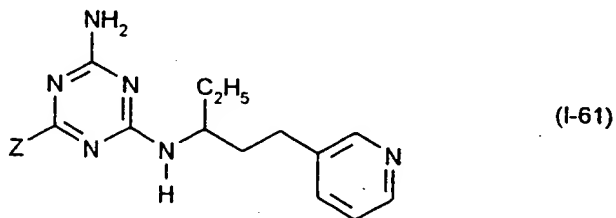
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

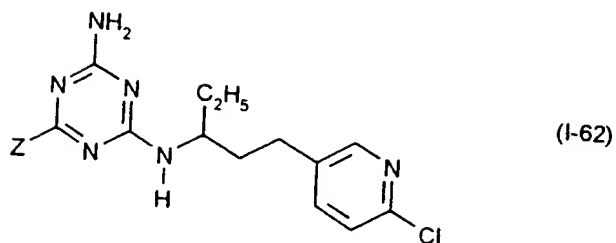
Gruppe 60

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

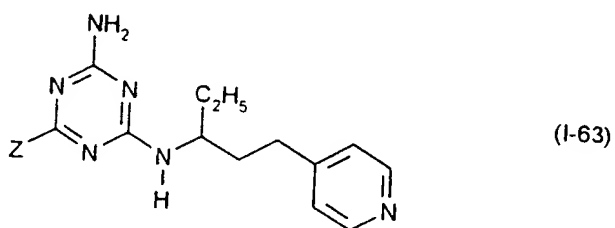
10

Gruppe 61

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

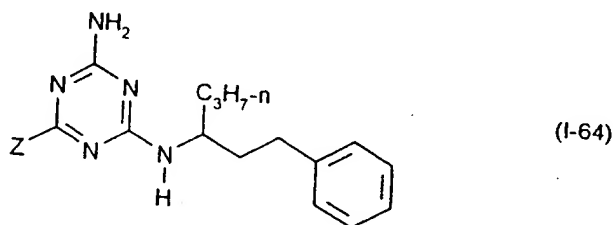
Gruppe 62

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 63

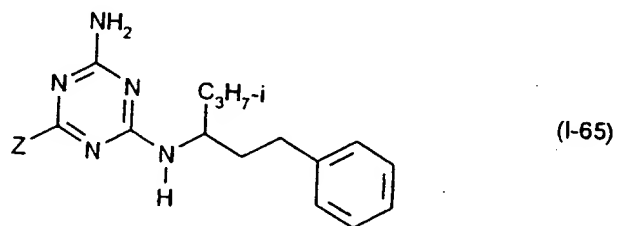
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

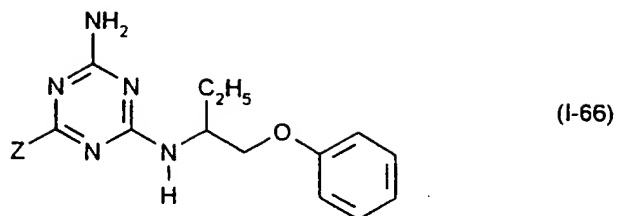
Gruppe 64

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

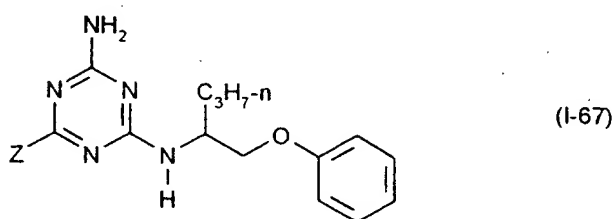
10

Gruppe 65

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

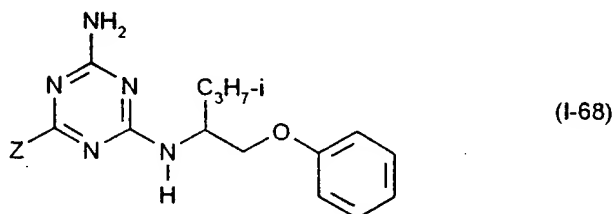
Gruppe 66

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 67

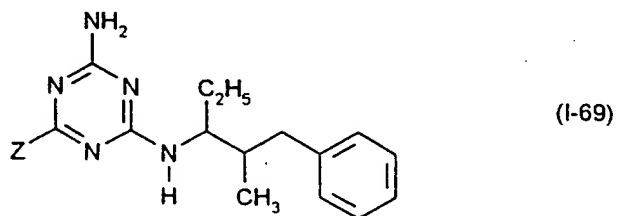
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

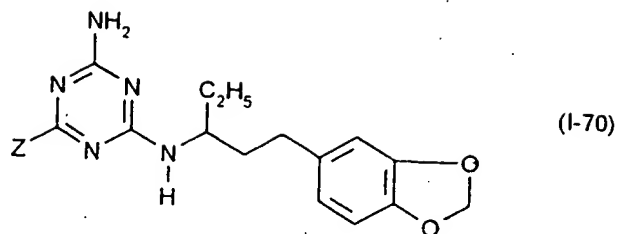
Gruppe 68

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

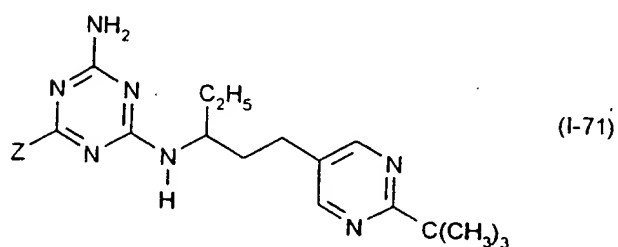
10

Gruppe 69

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

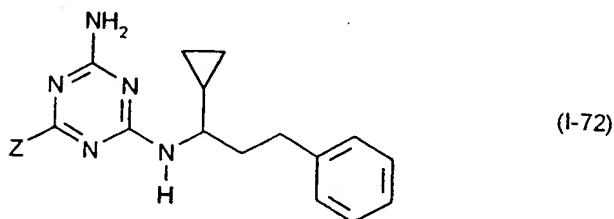
Gruppe 70

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 71

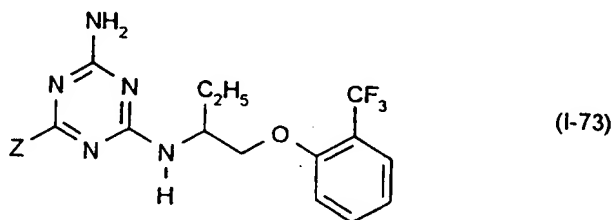
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 72

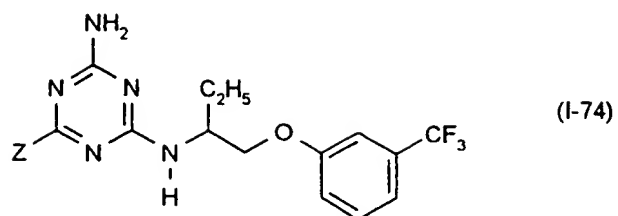
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

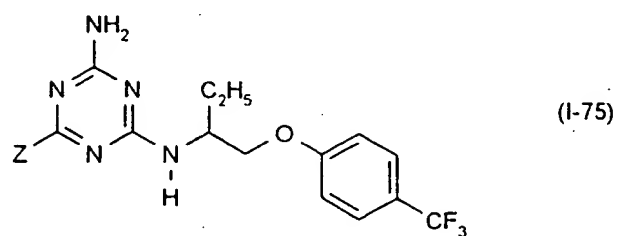
Gruppe 73

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.



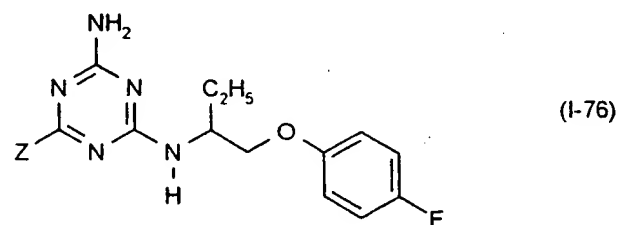
Gruppe 74

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 75

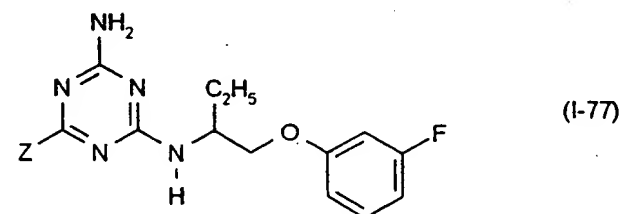
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

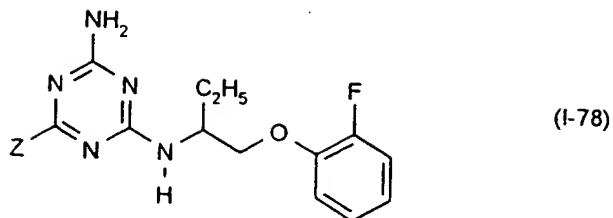
Gruppe 76

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

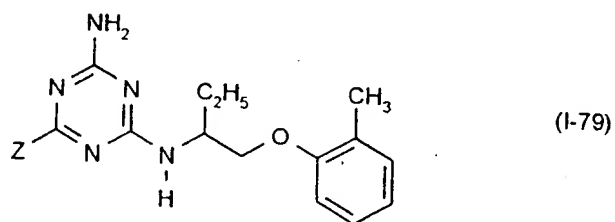
10

Gruppe 77

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

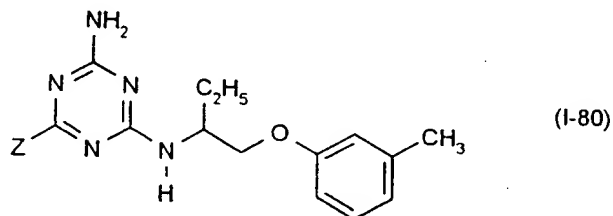
Gruppe 78

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 79

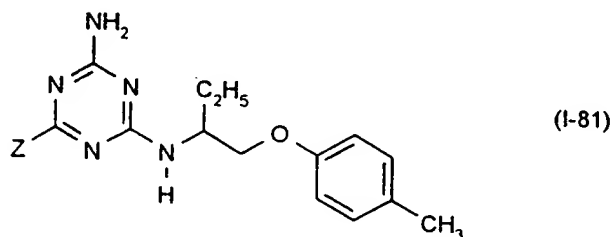
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

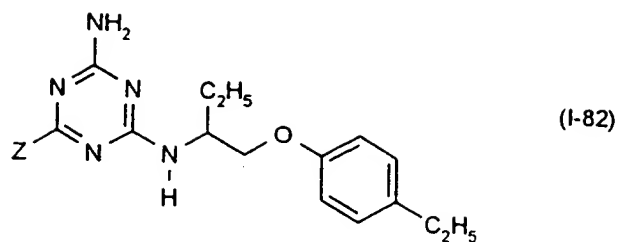
Gruppe 80

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

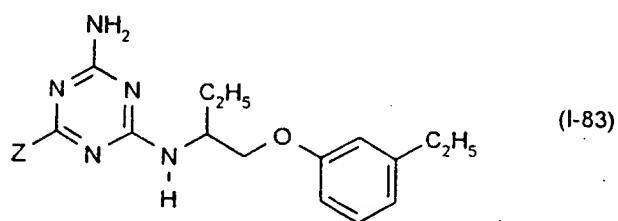
10

Gruppe 81

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

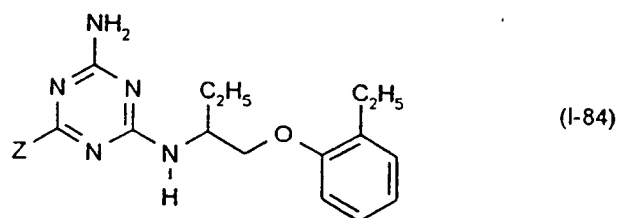
Gruppe 82

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 83

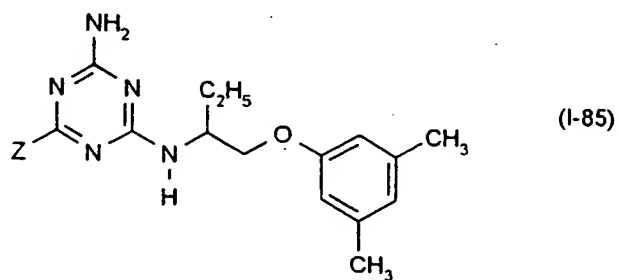
5

Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 84

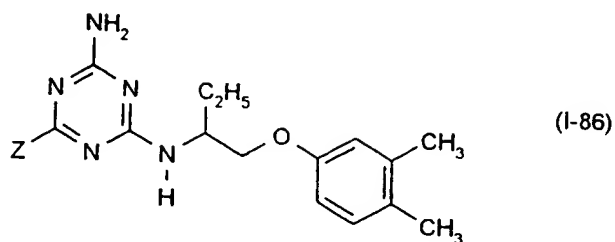
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 85

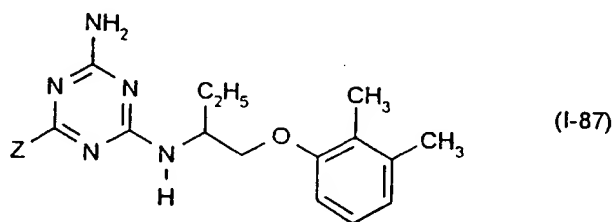
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 86



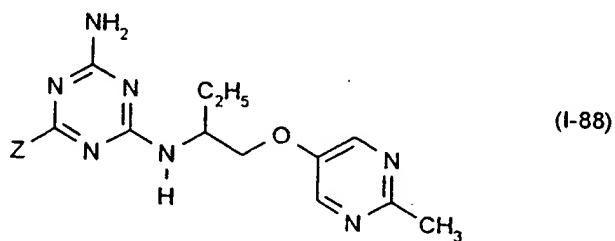
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5 Gruppe 87



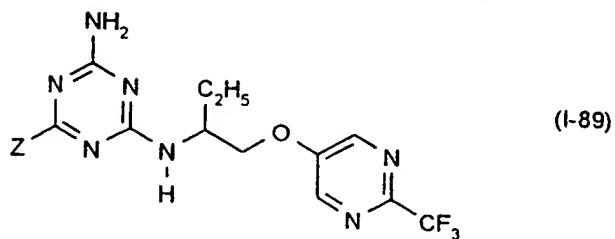
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 88



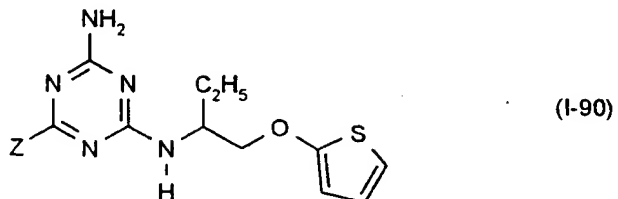
10 Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 89



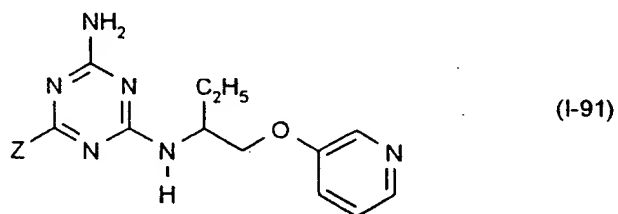
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 90



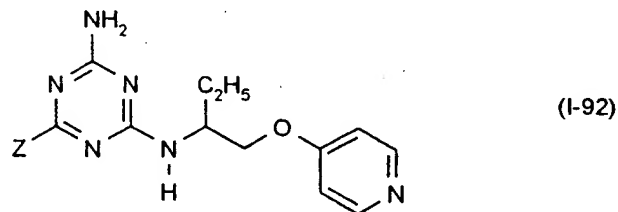
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5 Gruppe 91



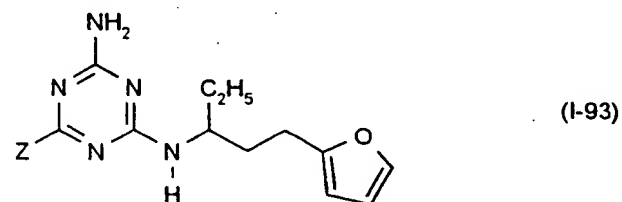
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 92



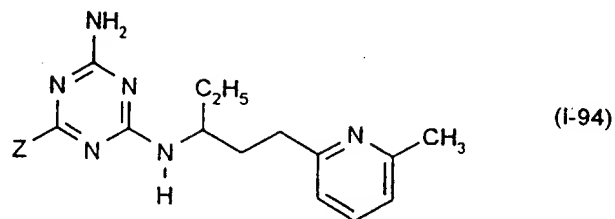
10 Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 93



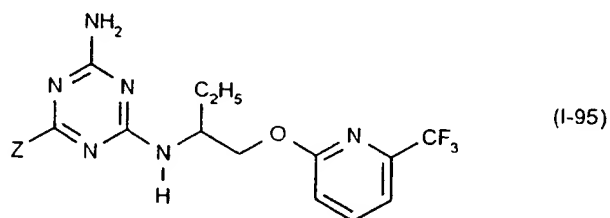
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 94



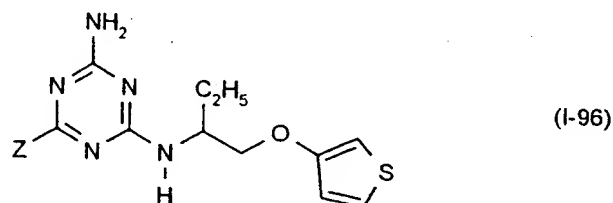
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5 Gruppe 95



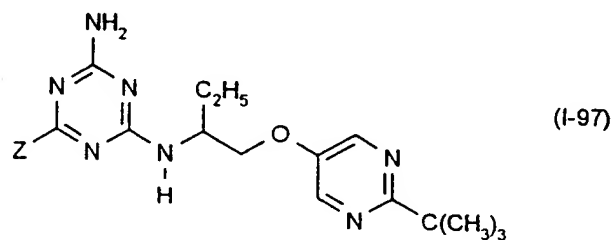
Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 96



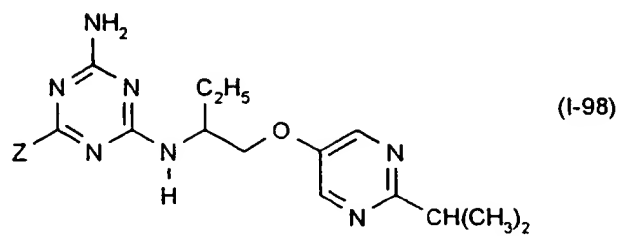
10 Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 97



Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

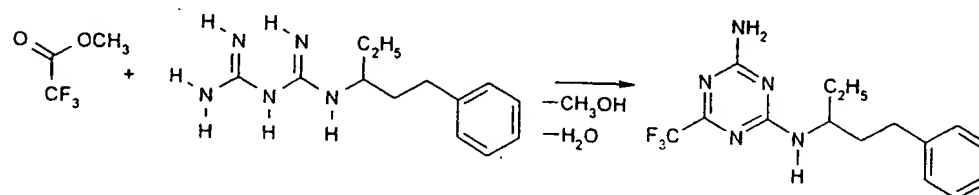
Gruppe 98



Z hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

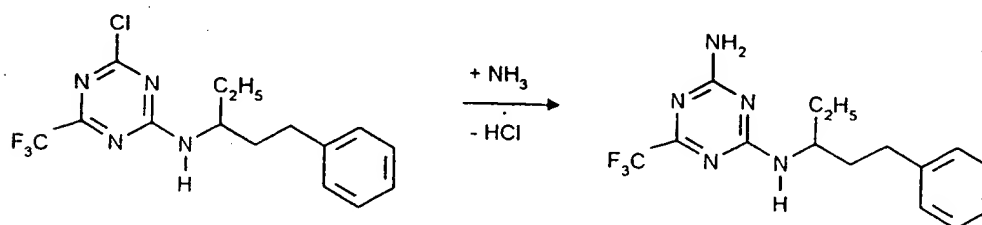
Verwendet man beispielsweise 1-(1-Ethyl-3-phenyl-propyl)-biguanid und Trifluor-essigsäuremethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

5



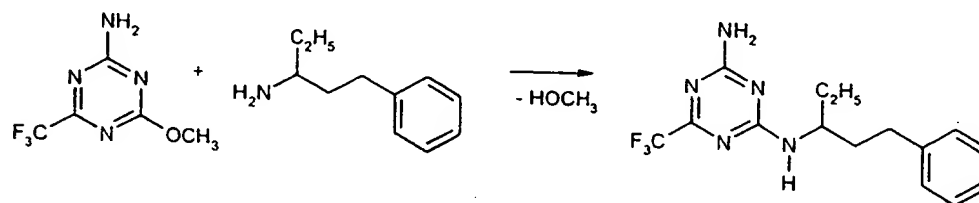
Verwendet man beispielsweise 2-Chlor-4-(1-ethyl-3-phenyl-propylamino)-6-trifluor-methyl-1,3,5-triazin und Ammoniak als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

10



Verwendet man beispielsweise 2-Amino-4-methoxy-6-trifluormethyl-1,3,5-triazin und 3-Phenyl-1-ethyl-propylamin als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

15



20

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Biguanide sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der Formel (II) haben  $R^1$ ,  $R^2$ , A und Ar vor-



zugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^1$ ,  $R^2$ , A und Ar angegeben wurden.

Als Beispiele für die substituierten Biguanide der Formel (II) seien genannt:

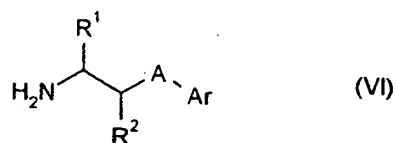
- 5  
1-(1-Ethyl-3-phenyl-propyl)-, 1-(1-n-Propyl-3-phenyl-propyl)-, 1-(1-i-Propyl-3-phenyl-propyl)-, 1-(1-Cyclopropyl-3-phenyl-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-fluor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-fluor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-fluor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-chlor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-chlor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-chlor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-brom-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-brom-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-brom-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-trifluor-  
10 methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-trifluormethoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethoxy-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfinyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfinyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfonyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfonyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(3,4-dichlor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2,4-dichlor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2,5-dichlor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2,6-dichlor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2,6-difluor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2,5-difluor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2,4-difluor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(3,4-difluor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(3,5-difluor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-chlor-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-chlor-phenyl)-  
20  
25  
30

propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-chlor-6-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(2-fluor-5-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-(5-fluor-2-methyl-phenyl)-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-thien-2-yl-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-thien-3-yl-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-pyridin-2-yl-propyl)-, 1-(1-Ethyl-3-pyridin-3-yl-propyl)- und 1-(1-Ethyl-3-pyridin-4-yl-propyl)- -biguanid.

Geeignete Säureaddukte von Verbindungen der Formel (II) sind deren Additionsprodukte mit Protonensäuren, wie z.B. mit Chlorwasserstoff (Hydrogenchlorid), Bromwasserstoff (Hydrogenbromid), Schwefelsäure, Methansulfonsäure, Benzolsulfonsäure und p-Toluolsulfonsäure.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (II) sind noch nicht aus der Literatur bekannt; sie sind als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Man erhält die neuen substituierten Biguanide der allgemeinen Formel (II), wenn man substituierte Alkylamine der allgemeinen Formel (VI)

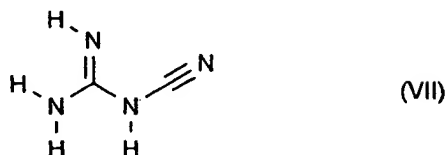


in welcher

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A und Ar die oben angegebene Bedeutung haben,

- und/oder Säureaddukte von Verbindungen der allgemeinen Formel (VI), wie z.B. die Hydrochloride -

mit Cyanoguanidin („Dicyandiamid“) der Formel (VII)



5 gegebenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels, wie z.B. Hydrogenchlorid, und gegebenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. n-Decan oder 1,2-Dichlor-benzol, bei Temperaturen zwischen 100°C und 200°C umgesetzt (vgl. EP 492615, Herstellungsbeispiele).

10 Die hierfür als Vorprodukte benötigten substituierten Alkylaminoverbindungen der allgemeinen Formel (VI) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. J. Med. Chem. 10 (1967), 717-724; J. Am. Chem. Soc. 97 (1975), 6900-6901; Tetrahedron Lett. 35 (1994), 3745-3746; DE 3222152; DE 3221540; EP 355351; EP 601486; Herstellungsbeispiele).

15 Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Alkoxycarbonylverbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der Formel (III) hat Z vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise  
20 bzw. als insbesondere bevorzugt für Z angegeben wurde; R' steht vorzugsweise für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere für Methyl oder Ethyl.

Die Ausgangsstoffe der Formel (III) sind bekannte Syntheschemikalien.

25 Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Triazine sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In der Formel (IV) haben R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A, Ar und Z vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A, Ar und Z angegeben

wurden; X<sup>1</sup> steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy, insbesondere für Chlor oder Methoxy.

Als Beispiele für die substituierten Triazine der Formel (IV) seien genannt:

5  
2-(1-Ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-  
(1-Ethyl-3-(3-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-phenyl)-propylami-  
no)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-chlor-phenyl)-  
propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-brom-  
10 phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-  
(4-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-  
Ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-,  
2-(1-Ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-pro-  
pylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluor-  
15 methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-,  
2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxy-phe-  
nyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-  
methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylami-  
no)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluor-  
20 methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluormethoxy-phenyl)-propylami-  
no)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-triflu-  
ormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propyl-  
amino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-  
methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-  
25 propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-  
methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfinyl-phenyl)-propylami-  
no)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methyl-  
sulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfonyl-phenyl)-propylami-  
no)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dichlor-phe-  
nyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-  
30 (2,6-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-difluor-phenyl)-propylamino)-,  
2-(1-Ethyl-3-(2,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-difluor-phenyl)-

propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(5-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- und 2-(1-Ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- -4,6-dichlor-1,3,5-triazin;

2-(1-Ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluor-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluor-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-

propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(5-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- und 2-(1-Ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- 4-chlor-6-methyl-1,3,5-triazin;

2-(1-Ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxy-phe-

- nyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(5-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- und 2-(1-Ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- 4-chlor-6-trifluormethyl-1,3,5-triazin;
- 2-(1-Ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-chlor-phenyl)-

propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluor-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluor-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(5-



fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- und 2-(1-Ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- -4-chlor-6-(1-fluor-ethyl)-1,3,5-triazin;

5

2-(1-Ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluoromethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-difluor-

30

phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(5-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- und 2-(1-Ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- 4-chlor-6-(1-fluor-1-methyl-ethyl)-1,3,5-triazin;

2-(1-Ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluor-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-

propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(5-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- und 2-(1-Ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- 4-chlor-6-methoxy-1,3,5-triazin;

2-(1-Ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxy-phe-

5  
 10  
 15  
 20  
 25  
 30

nyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluoromethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(5-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- und 2-(1-Ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- -4-chlor-6-(2,2,2-trifluor-ethoxy)-1,3,5-triazin;

2-(1-Ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-chlor-phenyl)-

propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluor-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxy-phe-nyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylami-no)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluor-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluormethoxy-phenyl)-propylami-no)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-tri-fluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-pro-pylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfinyl-phenyl)-propylami-no)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methyl-sulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfonyl-phenyl)-propylami-no)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-difluor-phenyl)-propylami-no)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-chlor-phenyl)-propyl-amino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-di-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-methyl-phenyl)-pro-pylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(5-

fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- und 2-(1-Ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- -4-chlor-6-methylthio-1,3,5-triazin;

5

2-(1-Ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluor-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluor-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-difluor-

30

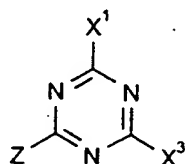
phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(5-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- und 2-(1-Ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- 4-chlor-6-methylsulfinyl-1,3,5-triazin;

2-(1-Ethyl-3-phenyl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-brom-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-nitro-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluor-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-difluor-methoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 1-(1-Ethyl-3-(3-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-trifluormethoxy-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-ethoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methoxycarbonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-ethoxycarbonyl-phenyl)-

propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylthio-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfinyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-methylsulfonyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-dichlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,6-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-difluor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-chlor-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,4-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(3,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2,5-dimethyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-chlor-6-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(4-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-4-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(2-fluor-5-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-(5-fluor-2-methyl-phenyl)-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-thien-3-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-2-yl-propylamino)-, 2-(1-Ethyl-3-pyridin-3-yl-propylamino)- und 2-(1-Ethyl-3-pyridin-4-yl-propylamino)- 4-chlor-6-methylsulfonyl-1,3,5-triazin.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (IV) sind noch nicht aus der Literatur bekannt; sie sind als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Man erhält die neuen substituierten Triazine der allgemeinen Formel (IV), wenn man Triazine der allgemeinen Formel (VIII)



(VIII)

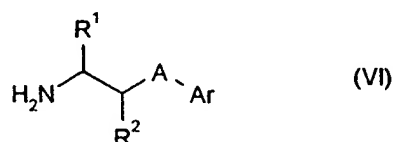


in welcher

X<sup>1</sup> und Z die oben angegebene Bedeutung haben und  
X<sup>3</sup> für Halogen steht,

5

mit substituierten Alkylaminen der allgemeinen Formel (VI)



10

in welcher

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A und Ar die oben angegebene Bedeutung haben,

15

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, wie z.B. Ethyldiisopropylamin, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Tetrahydrofuran oder Dioxan, bei Temperaturen zwischen -50°C und +50°C umgesetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

20

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Triazine sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In der Formel (V) hat Z vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für Z angegeben wurde; X<sup>2</sup> steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom, Methoxy oder Ethoxy, insbesondere für Chlor oder Methoxy.

25

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (V) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. WO 95/11237).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Alkylamine sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In der Formel (VI) haben  $R^1$ ,  $R^2$ , A und Ar vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der  
5 erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^1$ ,  $R^2$ , A und Ar angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (VI) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. DE 3426919; DE 4000610; DE  
10 4332738, EP 320898; EP 443606; Tetrahedron: Asymmetry 5 (1994), 817-820; Tetrahedron Lett. 29 (1988), 223-224; loc. cit. 36 (1995), 3917-3920; Herstellungsbeispiele).

Die erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I)  
15 werden gegebenenfalls unter Verwendung eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als Reaktionshilfsmittel für die Verfahren (a), (b) und (c) kommen im allgemeinen die üblichen anorganischen oder organischen Basen oder Säureakzeptoren in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall- acetate, -amide,  
20 -carbonate, -hydrogencarbonate, -hydride, -hydroxide oder -alkanolate, wie beispielsweise Natrium-, Kalium- oder Calcium-acetat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-amid, Natrium-, Kalium- oder Calcium-carbonat, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrogencarbonat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrid, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydroxid, Natrium- oder Kalium-  
25 -methanolat, -ethanolat, -n- oder -i-propanolat, -n-, -i-, -s- oder -t-butanolat; weiterhin auch basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Di-  
30 methyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methylpyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-Methyl-piperidin, 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]-octan (DABCO), 1,5-Diazabicyclo[4,3,0]-non-5-en (DBN), oder 1,8-Diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-en (DBU).

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) kommen vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Methyl-isopropylketon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid, Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, Ethylenglykolmonomethylether, Ethylenglykolmonoethylether, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 300°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 250°C.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, die erfindungsgemäßen Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuß zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im all-

gemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defolianten, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

10 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

15 Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus, Taraxacum.

20 Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

25 Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera, Phalaris.

30 Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

5 Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-,  
10 Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) eignen sich insbesondere zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen  
15 und dikotylen Kulturen sowohl im Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte  
20 Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also  
25 Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-  
30 naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfractionen, mineralische und pflanzliche

Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

- 5 Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor,
- 10 Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaum-erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkyl-aryl-polyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweiß-
- 15 hydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

- 20 Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

- 25 Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

- 30 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

- 5 Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise Acetochlor, Acifluorfen(-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxymid(-sodium), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Asulam, Atrazine, Azimsulfuron, Benazolin, Benfuresate, Bensulfuron(-methyl), Bentazon, Benzofenap, Benzoylprop(-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butylate,
- 10 Cafenstrole, Carbetamide, Chlormethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-ethyl), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cinmethylin, Cinosulfuron, Clethodim, Clodinafop(-propargyl), Clomazone, Clopyralid, Clopyrasulfuron, Cloransulam(-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham,
- 15 Diallate, Dicamba, Diclofop(-methyl), Difenzoquat, Diflufenican, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Diniramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Etobenzanid, Fenoxaprop(-ethyl), Flamprop(-isopropyl), Flamprop(-isopropyl-L), Flamprop(-methyl), Flazasulfuron, Fluazifop(-butyl), Flumetsulam, Flumiclorac(-pentyl),
- 20 Flumioxazin, Flumipropyn, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-ethyl), Flupoxam, Flupropacil, Flurenol, Fluridone, Fluroxypyr, Flurprimidol, Flurtamone, Fomesafen, Glufosinate(-ammonium), Glyphosate(-isopropylammonium), Halosafen, Haloxyfop(-ethoxyethyl), Hexazinone, Imazamethabenz(-methyl), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isoxaben, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-methyl), Molinate, Monolinuron, Napro-
- 25 anilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin,
- 30

5 Oxadiazon, Oxyfluorfen, Paraquat, Pendimethalin, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron(-methyl), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyributicarb, Pyridate, Pyrithiobac(-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quizalofop(-ethyl), Quizalofop(-p-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-methyl), Sulfosate, Tebutam, Tebuthiuron, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-methyl), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-methyl), Triclopyr, Tridiphane, 10 Trifluralin und Triflusulfuron.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstruktur-verbesserungsmitteln ist möglich.

15 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, 20 Sprühen, Streuen.

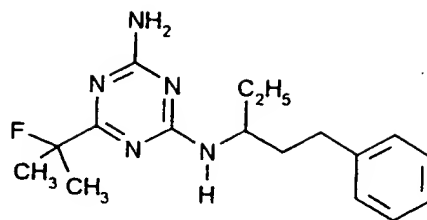
Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

25 Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

30



Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

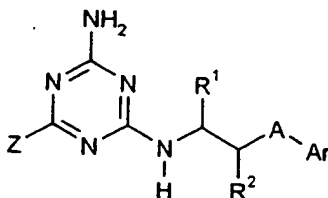
Herstellungsbeispiele:Beispiel 1

(Verfahren (a))

Eine Mischung aus 2,0 g (7 mMol) (R/S)-1-(1-Ethyl-3-phenyl-propyl)-biguanid-Hydrochlorid (racemisch), 1,89 g (14 mMol) 2-Fluor-isobuttersäure-ethylester, 0,76 g (14 mMol) Natriummethylat und 12 ml Methanol wird ca. 15 Stunden bei ca. 22°C gerührt. Dann wird mit Wasser auf etwa das dreifache Volumen verdünnt, mit Essigsäureethylester geschüttelt, die organische Phase abgetrennt mit Wasser gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel im Wasserstrahlvakuum sorgfältig abdestilliert. Der Rückstand wird durch Säulenchromatographie (Kieselgel, Essigsäureethylester) gereinigt.

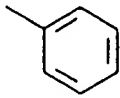
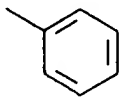
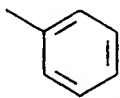
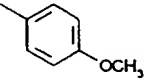
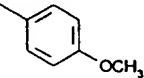
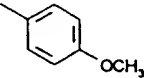
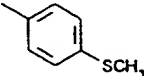
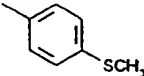
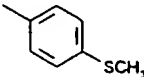
Man erhält 1,44 g (64% der Theorie) (R/S)-2-Amino-4-(1-fluor-1-methyl-ethyl)-6-(1-ethyl-3-phenyl-propylamino)-1,3,5-triazin (Racemat).

Analog Beispiel 1 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellungsverfahren können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) hergestellt werden.

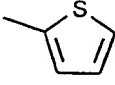
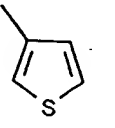
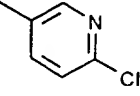
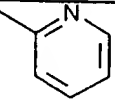
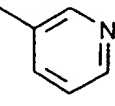
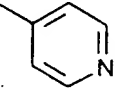
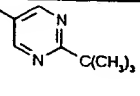
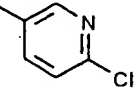
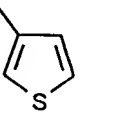


(I)

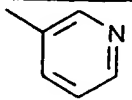
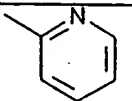
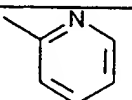
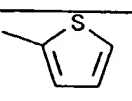
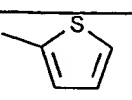
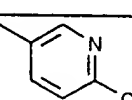
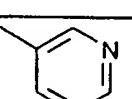
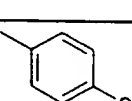
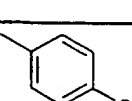
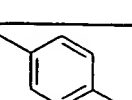
**Tabelle 1:** Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	A	Ar	Z	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	Fp.: 100°C (Racemat)
3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
4	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	(amorph) (S-Enantiomer)
5	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(Racemat)
6	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(R-Enantiomer)
7	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(S-Enantiomer)
8	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
9	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(R-Enantiomer)
10	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(S-Enantiomer)

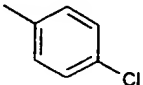
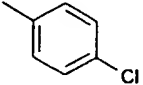
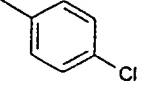
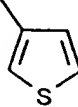
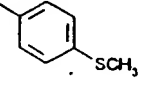
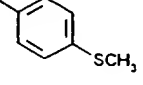
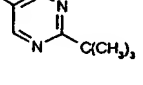
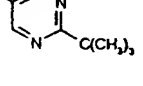
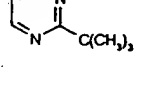
**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>		Az	Z	Physikal. Daten und stereoche- mische Angaben
11	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
12	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
13	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	Fp.: 74°C (Racemat)
14	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
15	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
16	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
17	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
18	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
19	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)

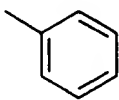
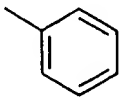
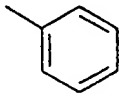
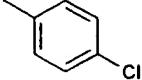
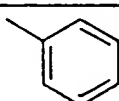
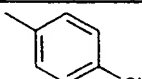
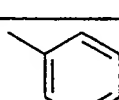
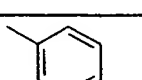
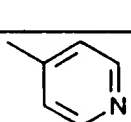
**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>		Az	Z	Physikal. Daten und stereoche- mische Angaben
20	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
21	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
22	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
23	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
24	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
25	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
26	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
27	C <sub>3</sub> H <sub>7-i</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
28	C <sub>3</sub> H <sub>7-i</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
29	C <sub>3</sub> H <sub>7-i</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)

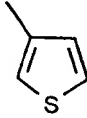
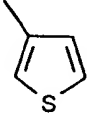
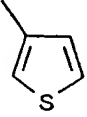
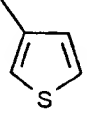
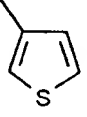
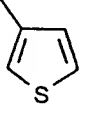
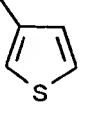
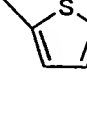
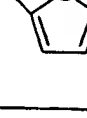
**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>		Az	Z	Physikal. Daten und stereoche- mische Angaben
30	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -n	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
31	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -n	H	CH <sub>2</sub>		CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
32	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -n	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
33	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
34	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
35	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
36	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
37	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
38	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(amorph) (Racemat)

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

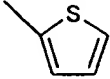
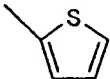
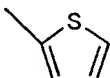
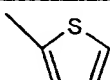
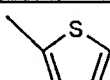
Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>		Az	Z	Physikal. Daten und stereoche- mische Angaben
39	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CHFCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
40	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(amorph) (Racemat)
41	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
42	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
43	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorph) (S-Enantiomer)
44	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	(amorph) (S-Enantiomer)
45	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
46	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		CF <sub>3</sub>	(amorph) (R-Enantiomer)
47	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)

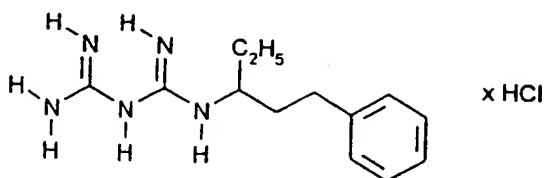
**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.- Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>		Az	Z	Physikal. Daten und stereoche- mische Angaben
48	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(amorph) (Racemat)
49	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
50	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
51	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHClCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
52	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHCl <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
53	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
54	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)
55	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
56	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)



**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp. - Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>		Az	Z	Physikal. Daten und stereoche- mische Angaben
57	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(amorph) (Racemat)
58	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
59	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
60	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHClCH <sub>3</sub>	(amorph) (Racemat)
61	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		CHCl <sub>2</sub>	(amorph) (Racemat)

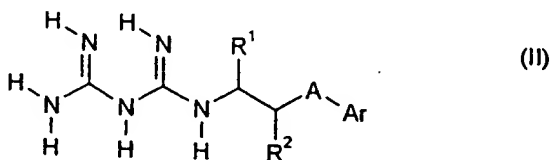
Ausgangsstoffe der Formel (II):Beispiel (II-1)

5 Eine Mischung aus 2,9 g (14,5 mMol) 1-Ethyl-3-phenyl-propylamin-Hydrochlorid (racemisch), 1,22 g (14,5 mMol) Cyanoguanidin (Dicyandiamid) und 30 ml 1,2-Dichlor-benzol wird 8 Stunden auf 140°C bis 150°C erhitzt. Das nach Abkühlen kristallin angefallene Produkt wird durch Absaugen isoliert.

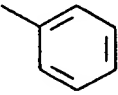
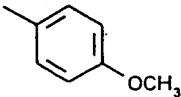
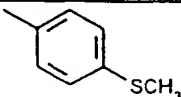
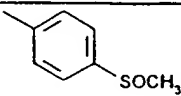
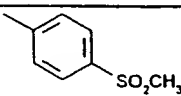
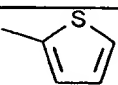
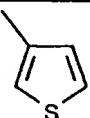
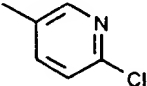
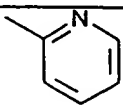
10 Man erhält 3,6 g (87% der Theorie) 1-(1-Ethyl-3-phenyl-propyl)-biguanid-Hydrochlorid (Racemat).

Die Umsetzung kann bei gleicher Temperatur auch ohne Lösungsmittel - d.h. in der Schmelze - durchgeführt werden.

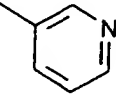
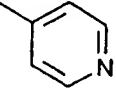
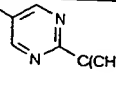
15 Analog Beispiel (II-1) können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der Formel (II) bzw. deren Hydrochloride hergestellt werden.

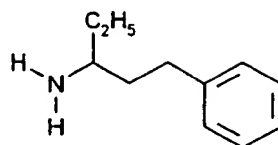


**Tabelle 2:** Beispiele für die Verbindungen der Formel (II) - (Hydrochloride)

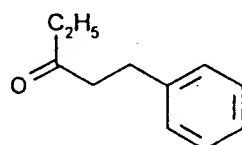
Bsp.-Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	A	Ar	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
(II-2)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		(Racemat)
(II-3)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(Racemat)
(II-4)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(Racemat)
(II-5)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(Racemat)
(II-6)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(Racemat)
(II-7)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(Racemat)
(II-8)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(Racemat)
(II-9)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(Racemat)
(II-10)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(Racemat)

**Tabelle 2** (Fortsetzung)

Bsp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	A	Ar	Physikal. Daten und stereochemische Angaben
(II-11)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(Racemat)
(II-12)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>		(Racemat)
(II-13)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	O		(amorph) (Hydrochlorid) (Racemat)

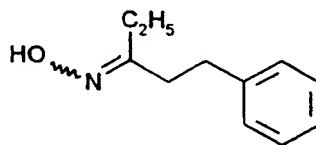
Ausgangsstoffe der Formel (V):Beispiel (V-1)

5

Stufe 1

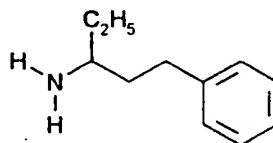
10 Eine Mischung aus 19,3 g (0,134 Mol) Propionylessigsäure-ethylester, 7,5 g (0,11 Mol) Natriumethylat, 60 ml Ethanol und 50 ml 10%iger wässriger Natronlauge wird bei Raumtemperatur (ca. 20°C) vorgelegt und nach Zutropfen von 12,6 g (0,10 Mol) Benzylchlorid wird die Reaktionsmischung ca. 5 Stunden bei ca. 60°C gerührt. Anschließend wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt und der Rückstand mit 50 ml 10%iger Natronlauge 3 Stunden bei ca. 60°C gerührt. Dann wird mit 10%iger wässriger Salzsäure auf pH 4 gestellt und mit Diethylether geschüttelt. Die organische Phase wird mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt und der Rückstand durch Säulenchromatographie (Kieselgel/Essigsäureethylester) gereinigt.

20 Man erhält 13,9 g (85% der Theorie) 1-Phenyl-pentan-3-on.

Stufe 2

5 Eine Mischung aus 13,9 g (86 mMol) 1-Phenyl-pentan-3-on, 8,9 g (128 mMol) Hydroxylamin-Hydrochlorid und 10,1 g (128 mMol) Pyridin wird 2 Stunden bei ca. 75°C gerührt. Nach Abkühlen wird mit Wasser/Essigsäureethylester geschüttelt, die organische Phase abgetrennt, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel im Wasserstrahlvakuum sorgfältig abdestilliert. Der Rückstand, der im wesentlichen die Verbindung 1-Phenyl-pentan-3-on-oxim der obigen Formel enthält, wird ohne weitere Reinigung für die nächst Stufe eingesetzt.

### Stufe 3



15 6,5 g (0,17 Mol) Lithiumaluminiumhydrid in 130 ml Tetrahydrofuran werden unter Rühren zu einer Mischung aus dem gemäß Beschreibung von Stufe 2 erhaltenen Produkt und 130 ml Tetrahydrofuran gegeben und die Reaktionsmischung wird 30 Minuten bei ca. 60°C gerührt. Nach Abkühlen wird mit einer Lösung von 1 g Natriumhydroxid in 30 ml Wasser versetzt und die Mischung wird 30 Minuten bei ca. 60°C gerührt. Nach Abkühlen wird filtriert und das Filtrat im Wasserstrahlvakuum eingeeengt. Der Rückstand wird durch Säulenchromatographie (Kieselgel, Essigsäureethylester) gereinigt.

20

Man erhält 6,3 g (45% der Theorie) (R/S)-1-Ethyl-3-phenyl-propylamin (Racemat).

Anwendungsbeispiele:Beispiel A

## 5      Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15      Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach ca. 24 Stunden wird der Boden mit der Wirkstoffzubereitung begossen. Dabei hält man die Wassermenge pro Flächeneinheit zweckmäßigerweise konstant. Die Wirkstoffkonzentration in der Zubereitung spielt keine Rolle, entscheidend ist nur die Aufwandmenge des Wirkstoffs pro Flächeneinheit.

20      Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

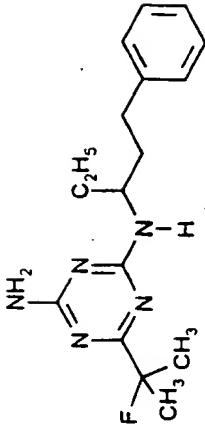
25      0 %      =    keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)  
         100 %    =    totale Vernichtung

30      In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1, 2, 12, 19, 21, 22, 29, 33, 41 und 45 bei teilweise guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, Weizen und Baumwolle, starke Wirkung gegen Unkräuter (vgl. Tabelle A).

In den nachfolgenden Tabellen bedeutet „ai.“ („active ingredient“) = Wirkstoff..

Tabelle A: Pre-emergence-Test/Gewächshaus

Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Mais	Baum- wolle	Alope- curus	Digi- taria	Abu- tilon	Galium	Matri- caria
---	------------------------------	------	----------------	-----------------	----------------	---------------	--------	-----------------



(1)

500

0

0

100

100

100

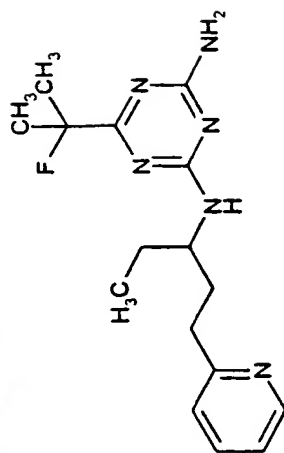
100

100



Tabelle A (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Weizen	Baum- wolle	Cheno- podium	Solanum	Veronica	Viola
---	------------------------------	--------	----------------	------------------	---------	----------	-------



(22)

500      0      0      100      100      100

Tabelle A (Fortsetzung)

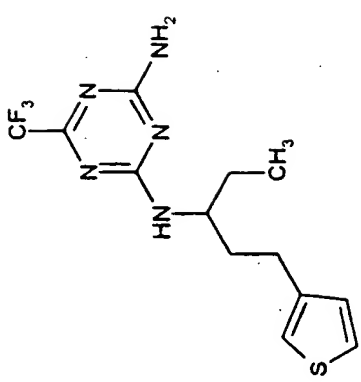
Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Wei- zen	Digi- taria	Echi- nochloa	Abu- tilon	Amaran- thus	Da- tura	Poly- gonum	Vero- nica
 (12)	500	0	80	100	100	100	100	100	100



Tabelle A (Fortsetzung)

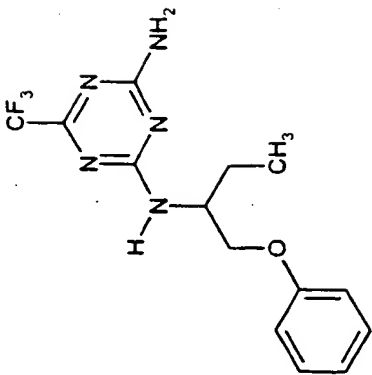
Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Mais	Abuti- lon	Amaran- thus	Sinapis
	1000	20	80	100	100
(2)					

Tabelle A (Fortsetzung)

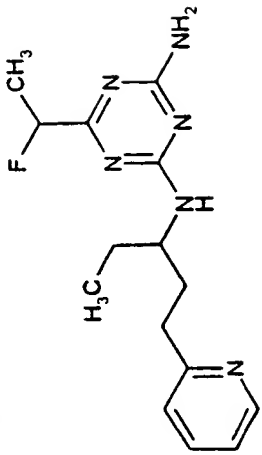
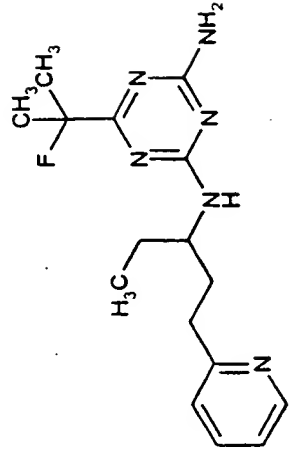
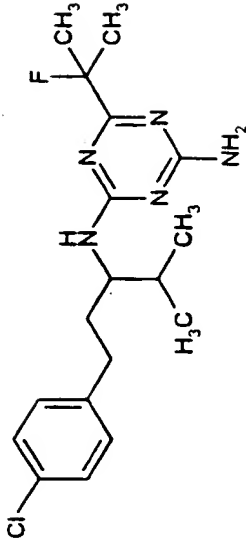
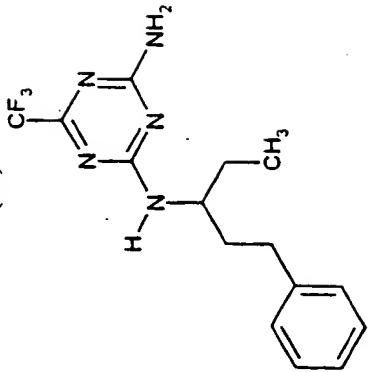
Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Alopecurus	Setaria	Abutilon	Amaranthus	Galium
 (21)	1000	100	90	90	95	80
 (22)	1000	90	70	100	95	100

Tabelle A (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai/ha)	Alope- curus	Setaria	Abuti- lon	Ama- ranthus	Galium
 (29)	1000	70	-	80	80	80
 (41)	1000	90	100	100	100	95

**Tabelle A** (Fortsetzung)

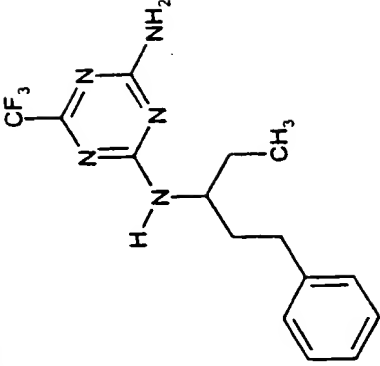
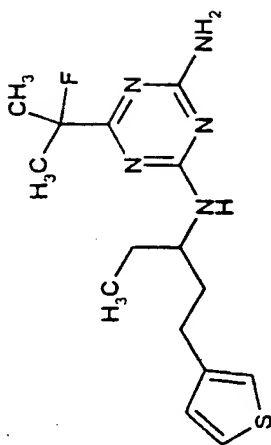
Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Setaria	Abuti- lon	Ama- ranthus	Galium
 (45)	1000	80	95	100	100

Tabelle A (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Alo- pecurus	Setaria	Abu- tilon	Ama- ranthus	Sinapis	Xan- thium
---	------------------------------	-----------------	---------	---------------	-----------------	---------	---------------



(33)

1000      100      100      90      100      90



Beispiel B

## Post-emergence-Test

5                                    Lösungsmittel:    5 Gewichtsteile Aceton  
                                      Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10                                   Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1  
Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die ange-  
gebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die ge-  
wünschte Konzentration.

15                                   Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 -  
15 cm haben so, daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit  
ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in  
1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

20                                   Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung  
im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

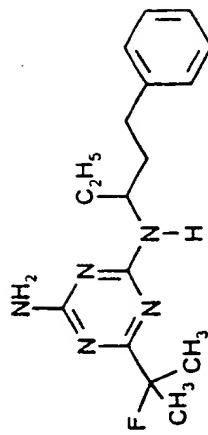
0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 % = totale Vernichtung

25                                   In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1,  
2, 4, 11, 12, 19, 22, 23, 24, 33, 41, 43, 44, 45 und 46 bei teilweise guter Verträglich-  
keit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais und Weizen, starke Wirkung gegen  
Unkräuter (vgl. Tabelle B).

Tabelle B: Post-emergence-Test/Gewächshaus

Wirkstoff gemäß Herstellungbeispiel-Nr. Aufwand- menge (g ai./ha) Weizen Echino- chloa Abutilon Datura Ipomoea Veronica



100

100

100

100

80

0

250

(1)

Tabelle B (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß  
Herstellungsbeispiel-Nr.

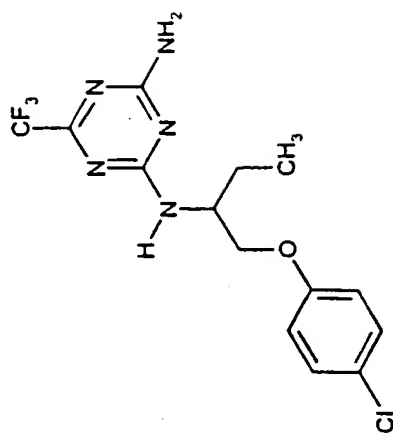
Aufwand-  
menge (g ai./ha)

Mais

Setaria

Ama-  
ranthus

Xanthium



1000

0

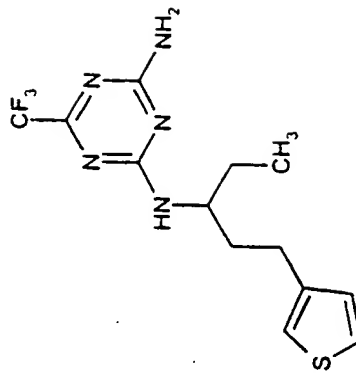
100

100

70

Tabelle B (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Weizen	Echino- chloa	Setaria	Ama- ranthus	Ipo- moca	Poly- gonum	Sola- num
---	------------------------------	--------	------------------	---------	-----------------	--------------	----------------	--------------



(12)

500

10

90

95

100

100

100

100

Tabelle B (Fortsetzung)

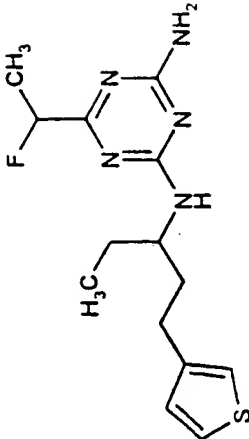
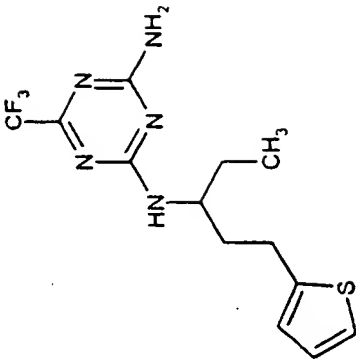
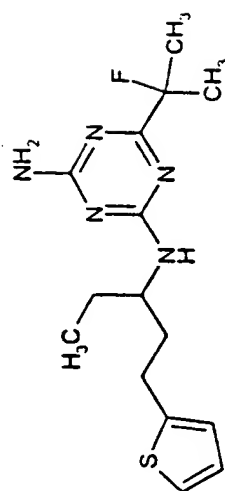
Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Weizen	Echino- clloa	Setaria	Ama- ranthus	Ipo- moea	Poly- gonum	Sola- num
 (19)	500	-	100	100	100	100	100	100
 (11)	500	10	80	95	100	100	100	100

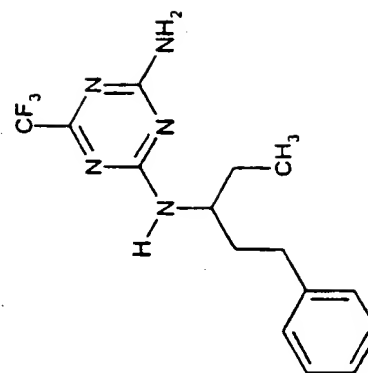
Tabelle B (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Weizen	Echino- chloa	Setaria	Ama- ranthus	Ipo- moea	Poly- gonum	Sola- num
---	------------------------------	--------	------------------	---------	-----------------	--------------	----------------	--------------



(24)

500	-	100	80	100	100	100	95	95
-----	---	-----	----	-----	-----	-----	----	----



(43)

500	10	-	90	100	100	100	100	100
-----	----	---	----	-----	-----	-----	-----	-----

- 90 -

Tabelle B (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß  
Herstellungsbeispiel-Nr.

Aufwand-  
menge (g ai./ha)

Alope-  
curus

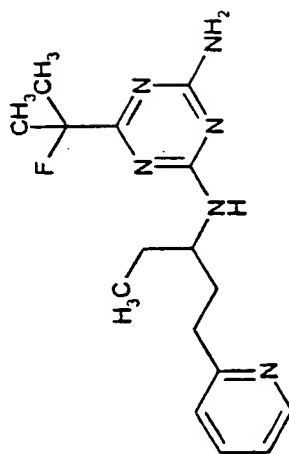
Seta-  
ria

Abu-  
tilon

Ama-  
ranthus

Galium

Xan-  
thium



(22)

1000

-

80

70

95

80

70

Tabelle B (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß  
Herstellungsbeispiel-Nr.

Aufwand-

menge (g ai./ha)

Alope-

curus

Seta-

ria

Abu-

tilon

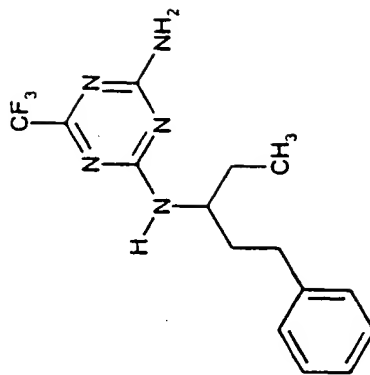
Ama-

ranthus

Galium

Xan-

thium



(41)

1000

80

100

100

100

100

100



Tabelle B (Fortsetzung)

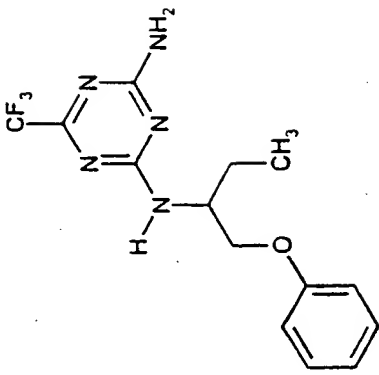
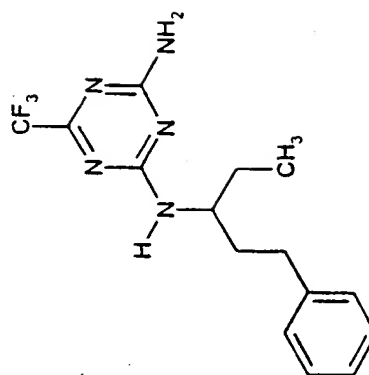
Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Alopec- urus	Seta- ria	Abu- tilon	Ama- ranthus	Galium	Xan- thium
 (2)	1000	70	100	100	100	100	100

Tabelle B (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Alope- curus	Seta- ria	Abu- tilon	Ama- ranthus	Galium	Xan- thium
	1000	-	100	100	100	70	100



(43)

Tabelle B (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß  
Herstellungsbeispiel-Nr.

Aufwand-  
menge (g ai./ha)

Alope-  
curus

Seta-  
ria

Abu-  
tilon

Ama-  
ranthus

Galium

Xan-  
thium

100

80

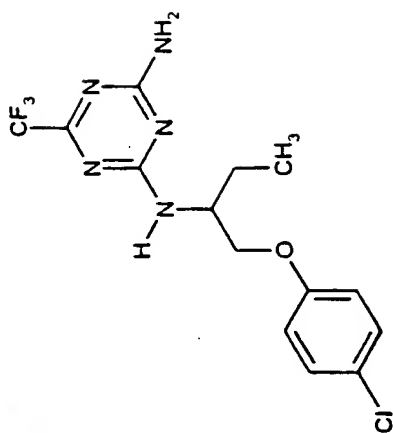
100

100

100

80

1000



(44)

Tabelle B (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß  
Herstellungsbeispiel-Nr.

Aufwand-  
menge (g ai./ha)

Alope-  
curus

Seta-  
ria

Abu-  
tilon

Ama-  
ranthus

Galium

Xan-  
thium

80

100

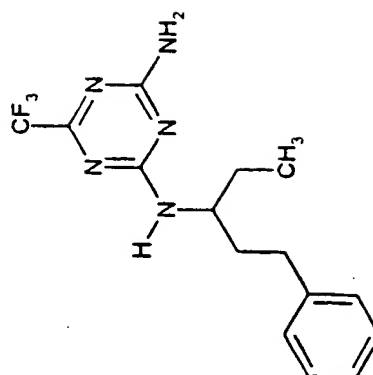
100

100

100

80

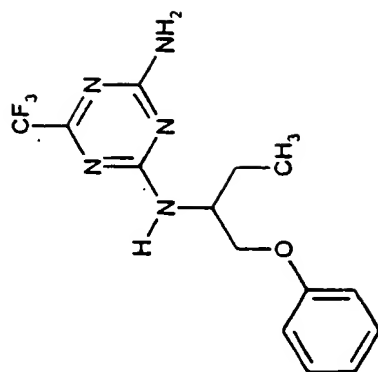
1000



(45)

Tabelle B (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Alope- curus	Seta- ria	Abu- tilon	Ama- ranthus	Galium	Xan- thium
	1000	70	100	100	100	80	100



(4)

Tabelle B (Fortsetzung)

Wirkstoff gemäß  
Herstellungsbeispiel-Nr.

Aufwand-  
menge (g ai./ha)

Alope-  
curus

Avena  
fatua

Cy-  
perus

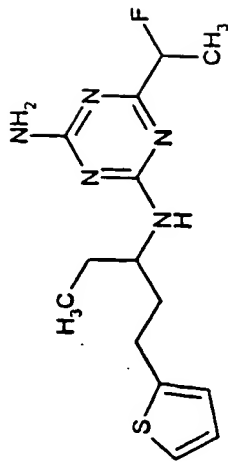
Se-  
taria

Abu-  
tilon

Ama-  
ranthus

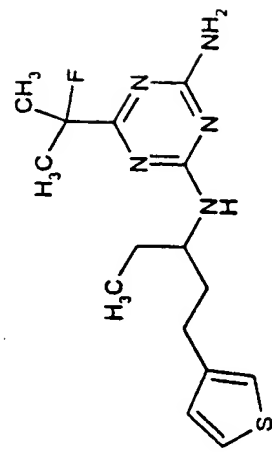
Sina-  
pis

Xan-  
thium



(23)

1000 90 100 100 100 100 100 100



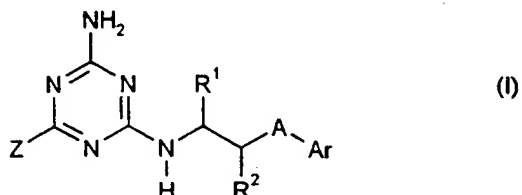
(33)

1000 80 100 90 100 100 100 100

**Patentansprüche**

1. Substituierte 2-Amino-4-alkylamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I)

5



in welcher

- 10             $R^1$     für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- $R^2$     für Wasserstoff oder für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,
- 15             $A$      für Sauerstoff oder Methylen steht,
- $Ar$     für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl steht, und
- 20             $Z$      für Wasserstoff, für Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkenyl oder Alkinyl steht.
- 25            2. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß
- $R^1$     für gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy substituiertes Alkyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für ge-

gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht,

A für Sauerstoff oder Methylen steht,

Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl steht,

wobei die möglichen Heterocyclylgruppierungen aus der folgenden Gruppe ausgewählt sind:

Furyl, Benzofuryl, Dihydrobenzofuryl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Thiadiazolyl, Oxadiazolyl, Pyrazolyl, Pyrrolyl, Chinoliny, Isochinoliny, Pyridiny und Pyrimidiny,

und wobei die möglichen Substituenten jeweils aus folgender Gruppe ausgewählt sind:

Hydroxy, Cyano, Nitro, Halogen, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano oder Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylcarbonyl, Alkoxy carbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Phenoxy, sowie jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Methylendioxy oder Ethylendioxy,

und

Z für Wasserstoff, für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-



5 sulfanyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkyl-carbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht.

3. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß darin

10 R<sup>1</sup> für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

15

R<sup>2</sup> für Wasserstoff oder Methyl steht,

A für Sauerstoff oder Methylen steht,

20

Ar für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl steht,

wobei die möglichen Heterocyclylgruppierungen aus der folgenden Gruppe ausgewählt sind:

25

Furyl, Benzofuryl, Dihydrobenzofuryl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Thiadiazolyl, Oxadiazolyl, Pyrazolyl, Pyrrolyl, Chinoliny, Isochinoliny, Pyridiny und Pyrimidiny,

und wobei die möglichen Substituenten jeweils aus folgender Gruppe ausgewählt sind:

30

Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Fluor oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, jeweils gegebenenfalls durch Fluor

5 oder Chlor substituiertes Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy oder Trifluormethoxy substituiertes Phenyl oder Phenoxy, sowie jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Methylendioxy oder Ethylendioxy,

10

und

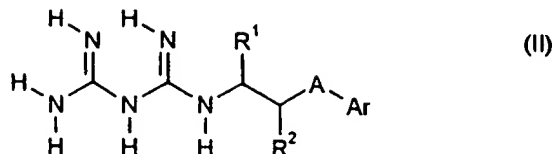
15 Z für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Nitro, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Ethinyl, Propinyl oder Butinyl

20

25 steht.

4. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man

30 (a) substituierte Biguanide der allgemeinen Formel (II)



in welcher

- 5             $R^1$ ,  $R^2$ , A und Ar    die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben,  
 - und/oder Säureaddukte von Verbindungen der allgemeinen Formel (II) -  
 mit Alkoxycarbonylverbindungen der allgemeinen Formel (III)

10



in welcher

- 15            Z            die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat und  
                $R'$         für Alkyl steht,

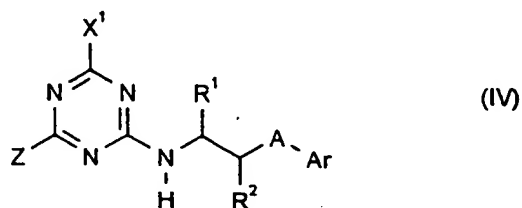
20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in  
 Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder daß man

- (b) substituierte Triazine der allgemeinen Formel (IV)

25



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , A, Ar und Z die oben angegebene Bedeutung haben und

5

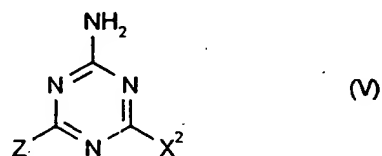
$X^1$  für Halogen oder Alkoxy steht,

mit Ammoniak gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und  
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

10

oder daß man

(c) substituierte Triazine der allgemeinen Formel (V)



15

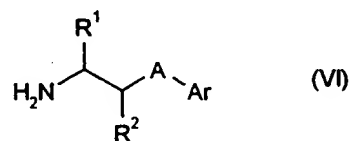
in welcher

Z die oben angegebene Bedeutung hat und

20

$X^2$  für Halogen oder Alkoxy steht,

mit substituierten Alkylaminen der allgemeinen Formel (VI)



25

in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , A und Ar die oben angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

5

und gegebenenfalls an den gemäß den unter (a), (b) oder (c) beschriebenen Verfahren erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der obigen Substituentendefinition weitere Umwandlungen nach üblichen Methoden durchführt.

10

5. Herbizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß Anspruch 1.

15

6. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwachstum.

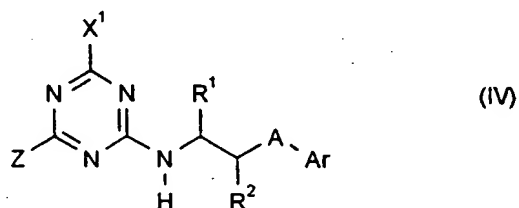
20

7. Verfahren zur Bekämpfung von Unkräutern, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Unkräuter oder ihren Lebensraum einwirken läßt.

8. Verfahren zur Herstellung von herbiziden Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln vermischt.

25

9. Substituierte Triazine der allgemeinen Formel (IV),



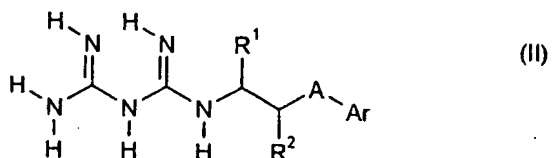
in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , A, Ar und Z die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben und

$X^1$  für Halogen oder Alkoxy steht.

5

10. Substituierte Biguanide der allgemeinen Formel (II),



10

in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , A und Ar die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben,

und/oder Säureaddukte von Verbindungen der allgemeinen Formel (II).

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 97/05318

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 6 C07D251/18 A01N43/68 C07D401/12 C07D409/12

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 273 328 A (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD) 6 July 1988 cited in the application see claims ---	1,5
A	EP 0 411 153 A (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD) 6 February 1991 cited in the application see claims ---	1,5
A	EP 0 509 544 A (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD) 21 October 1992 see claims --- -/--	1,5,10

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

### \* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

11 February 1998

Date of mailing of the international search report

25/02/1998

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Van Bijlen, H

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

I. Application No  
PCT/EP 97/05318

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 97 08156 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 6 March 1997 cited in the application * Tabelle I, Nr. 92,93; Tabelle II, Seite 43-47 * -----	1-3,5



# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 97/05318

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 273328 A	06-07-88	DE 3789294 D DE 3789294 T JP 1853764 C JP 63264465 A US 4844731 A	14-04-94 16-06-94 07-07-94 01-11-88 04-07-89
EP 411153 A	06-02-91	AT 142630 T AU 628138 B AU 5082790 A CA 2027562 A,C DE 69028461 D DE 69028461 T EP 0620220 A ES 2094150 T WO 9009378 A JP 7112981 A JP 7039400 B KR 9401728 B LV 10864 B RU 2058983 C US 5403815 A US 5290754 A LT 640 A,B	15-09-96 10-09-92 05-09-90 21-08-90 17-10-96 06-02-97 19-10-94 16-01-97 23-08-90 02-05-95 01-05-95 05-03-94 20-06-96 27-04-96 04-04-95 01-03-94 27-12-94
EP 509544 A	21-10-92	JP 2653600 B JP 5320145 A US 5250686 A	17-09-97 03-12-93 05-10-93
WO 9708156 A	06-03-97	DE 19531084 A AU 6741896 A	27-02-97 19-03-97

PCT/EP 97/05318

IPK 6 C07D251/18 A01N43/68 C07D401/12 C07D409/12

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

IPK 6 C07D A01N

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

Kategorie<sup>2</sup>

Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile

Belr. Anspruch Nr.

1.5

1.5

1, 5, 10

-/-

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\*-> Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

11. Februar 1998

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

25/02/1998

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Van Bijlen, H

# INTERNATIONAL RECHERCHENBERICHT

ationales Aktenzeichen

PCT/EP 97/05318

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P,X	<p>WO 97 08156 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 6.März 1997 in der Anmeldung erwähnt * Tabelle I, Nr. 92,93; Tabelle II, Seite 43-47 *</p> <p>-----</p>	1-3,5